

[19]中华人民共和国专利局



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 95194436.3

[51]Int.Cl⁶

C07D231/22
A01N 43/56 C07D231/20
C07D401/04 C07D403/04
C07C239/10 C07C271/28
C07C271/58

[43]公开日 1997年7月16日

[11] 公开号 CN 1154692A

[22]申请日 95.6.21

[30]优先权

[32]94.7.6 [33]DE31P4423612.3

[86]国际申请 PCT/EP95/02396 95.6.21

[87]国际公布 WO96/01256 德 96.1.18

[85]进入国家阶段日期 97.1.30

[71]申请人 巴斯福股份公司

地址 联邦德国路德维希港

[72]发明人 B·穆勒 H·克尼格 R·基尔斯根
K·奥伯多尔福 F·罗尔 N·格兹
H·萨特 G·劳伦兹
E·阿莫曼

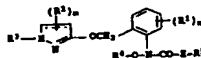
[74]专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标
事务所
代理人 李 勇

权利要求书 6 页 说明书 66 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 2-[(二氢)吡啶-3'-基氧亚甲基]苯胺的酰胺及其制备方法和用途

[57]摘要

本发明涉及式(I)的2-[(二氢)吡啶基-3'-氧亚甲基]苯胺的酰胺, 式中: --- 为单键或双键; n 为 0、1、2、3 或 4; m 为 0、1 或 2; X 为直键或 CH_2 、氧或 NR^4 ; R^4 为氢、烷基、链烯基、炔基、环烷基或环烯基; R^1 为硝基、氰基、卤, 或者可被取代的烷基、链烯基、炔基、烷氧基、链烯氧基或炔氧基; R^2 为硝基、氰基、卤、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷硫基或烷氧基羰基; R^3 为可被取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、杂环基、芳基或杂芳基; R^4 为氢或可被取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烯基、烷氧基或烷氧基羰基; R^5 为氢、烷基、链烯基、炔基、环烷基或环烯基。本发明还涉及制备这些化合物的方法和中间体以及它们的用途。



(BJ)第 1456 号

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

[12] 发明专利说明书

[21] ZL 专利号 95194436.3

C07D231/22

A01N 43/56

C07D231/20 C07D401/04

C07D403/04 C07C239/10

C07C271/28 C07C271/58

[45] 授权公告日 2001 年 7 月 11 日

[11] 授权公告号 CN 1068313C

[22] 申请日 1995.6.21 [24] 颁证日 2001.4.12

[21] 申请号 95194436.3

[30] 优先权

[32] 1994.7.6 [33] DE [31] P4423612.3

[86] 国际申请 PCT/EP95/02396 1995.6.21

[87] 国际公布 WO96/01256 德 1996.1.18

[85] 进入国家阶段日期 1997.1.30

[73] 专利权人 巴斯福股份公司

地址 联邦德国路德维希港

[72] 发明人 B·穆勒 H·克尼格 R·基尔斯根

K·奥伯多尔福 F·罗尔 N·格兹

H·萨特 G·劳伦兹 E·阿莫曼

[56] 参考文献

W09315046 1993.8.5 C07C271/28

W09315046 1993.8.5 C07C271/28

审查员 耿文军

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事
务所

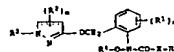
代理人 李 勇

权利要求书 5 页 说明书 66 页 附图页数 0 页

[54] 发明名称 2-[(二氢)吡唑-3'-基氧亚甲基]苯胺
的酰胺及其制备方法和用途

[57] 摘要

本发明涉及式(I)的2-[(二氢)吡唑基-3'-氧亚甲基]苯胺的酰胺, 式中: —为单键或双键; n 为 0、1、2、3 或 4; m 为 0、1 或 2; X 为直键或 CH₂、氧或 NR², R² 为氢、烷基、链烯基、炔基、环烷基或环烯基; R¹ 为硝基、氟基, 卤, 或者可被取代的烷基、链烯基、炔基、烷氧基、链烯氧基或炔氧基; R³ 为硝基、氟基、卤、烷基、卤代烷基、烷氧基、烷硫基或烷氧基羰基; R⁴ 为可被取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、杂环基、芳基或杂芳基; R⁵ 为氢或可被取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烯基、烷氧基或烷氧基羰基; R⁶ 为氢、烷基、链烯基、炔基、环烷基或环烯基。本发明还涉及制备这些化合物的方法和中间体以及它们的用途。



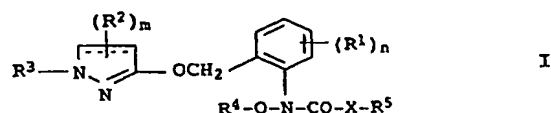
知识产权出版社出版

ISSN 1008-4274

00-09-27

权 利 要 求 书

1. 式 I 所示 2-[(二氢)吡唑-3'-基氧亚甲基]苯胺的酰胺



其中: --- 为单键或双键, 符号为取代基具有下列含义:

n 为 0、1、2、3 或 4, 如果 n 大于 1, 取代基 R^1 可以不相同;

m 为 0、1 或 2, 如果 m 大于 1, 取代基 R^2 可以不相同;

X 为直链、O 或 NR^a , 其中的 R^a 为氢、烷基、链烯基、炔基、环烷基或环烯基;

R^1 为硝基、氰基、卤原子、烷基、链烯基、炔基、烷氧基、链烯基氧基、炔基氧基, 或者当 n 为 2 时, 两个 R^1 还可以形成连接两个相邻环原子的 3-4 元桥连基团, 该桥连基团主链含有 3 或 4 个碳原子、或者含有 1-3 个碳原子和 1 或 2 个氮、氧和/或硫原子, 它同与它们相连的环可形成部分不饱和或芳香基团;

R^2 为硝基、氰基、卤原子、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基或 C_1 - C_4 烷氧基羰基;

R^3 为苯基或苄基, 其中的苯环可被部分或完全卤代和/或带有 1-3 个下列基团: 氰基, 硝基, C_1 - C_6 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_4 卤代烷氧基, C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基, C_3 - C_6 环烷基, C_1 - C_4 烷基羰基, C_1 - C_4 烷氧基羰基, 苯基, 苯氧基和苯基- C_1 - C_4 烷氧基, 这些基团中的苯环又可被部分或全部卤代和/或带有 1-3 个下列基团: 氰基, 硝基, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_2 卤代烷基, C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_2 卤代烷氧基, C_3 - C_6 环烷基, C_1 - C_4 烷基羰基或 C_1 - C_4 烷氧基羰基, 和/或

- 基团 $\text{CR}' = \text{NOR}''$, 其中的 R' 为氢或 C_1 - C_4 烷基, R'' 为 C_1 -

00-00-27

C₆烷基, 和/或

- 连接苯环上两个相邻 C 原子的氧基 - C₁ - C₃ 烷氧基或氧基 - C₁ - C₃ 卤代烷氧基的桥连基团; 或者

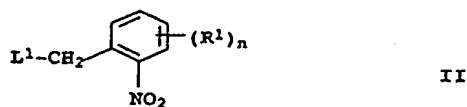
R³ 为吡啶基或嘧啶基, 其中的吡啶环可被部分或完全卤代和/或带有 1-3 个下列基团: 氟基, 硝基, C₁ - C₄ 烷基, C₁ - C₂ 卤代烷基, C₁ - C₄ 烷氧基, C₁ - C₂ 卤代烷氧基, C₃ - C₆ 环烷基, C₁ - C₄ 烷基羰基或 C₁ - C₄ 烷氧基羰基;

R⁴ 为氢, 烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烯基、烷基羰基或烷氧基羰基;

R⁵ 为烷基、链烯基、炔基、环烷基或环烯基, 或者当 X 为 NR^a 时, R⁵ 还可以是氢。

2. 权利要求 1 的式中 R⁴ 为氢的式 I 所示化合物的制备方法, 它包括:

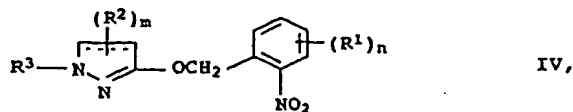
在碱存在下, 用式 III 所示 3-羟基(二氢)吡唑将式 II 所示苯基衍生物



式中 L¹ 为可被亲核置换的基团

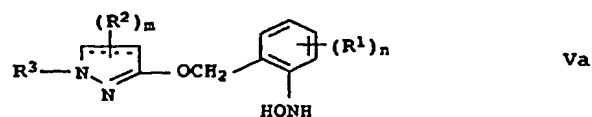


转化成相应的式 IV 所示 2-[(二氢)吡唑-3'-基氧亚甲基]硝基苯



00.09.27

然后, 将 IV 还原成式 Va 所示 N-羟基苯胺



并使用式 VI 所示羰基化合物

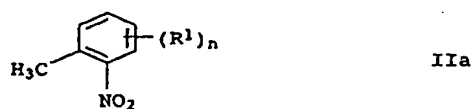


式中, L^2 为卤原子, X 为直键或氧原子

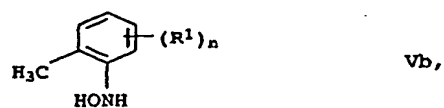
将 Va 转化成 I.

3. 式中 R^4 不为氢并且 X 是直键或氧的式 I 所示化合物的制备方法, 它包括:

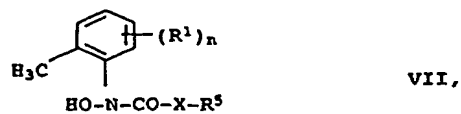
首先, 将式 IIa 所示甲基衍生物



还原成相应的式 Vb 所示羟基苯胺

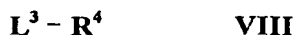


使用权利要求 2 中所述的式 VI 所示羰基化合物将 Vb 转化成相应的式 VII 所示苯胺的酰胺

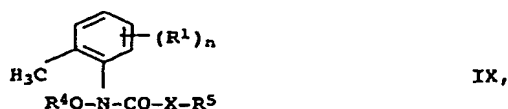


00.09.27

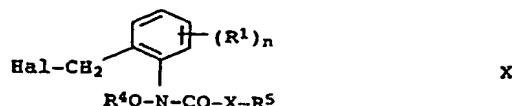
然后, 使用化合物 VIII



式中, L^3 为可被亲核置换的基团, R^4 不是氢原子
将 VII 转化成式 IX 所示酰胺



此后, 将 IX 转化成相应的式 X 所示苄基卤化物

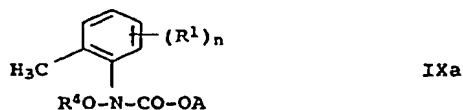


式中的 Hal 为卤原子

并且, 在碱的存在下, 用权利要求 2 中所述的式 III 所示 3-羟基(二氢)吡唑将 X 转化成 I.

4. 权利要求 1 的式中 R^4 不为氢并且 X 是直链或氧的式 I 所示化合物的制备方法, 它包括, 使相应的式 R^4 为氢的式 I 所示化合物与权利要求 3 中所述的式 VIII 化合物反应.

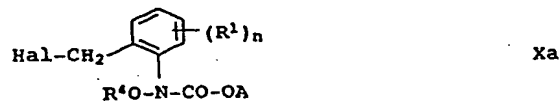
5. 式中 X 为 NR^a 的式 I 所示化合物的制备方法, 它包括:
将式 IXa 所示甲基苯胺的酰胺



式中的 A 为烷基或苯基

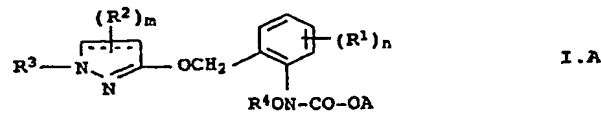
00.09.27

转化成相应的式 Xa 所示苄基卤化物



式中的 Hal 为卤原子

在碱的存在下,使用权利要求 2 中所述的式 III 所示 3-羟基(二氨)吡唑将 Xa 转化成式 I.A 所示化合物



然后,使 I.A 与式 XI 所示胺反应



(XIa)



(XIb)

得到 I.

6. 适于防治动物害虫或有害真菌的组合物,它含有固体或液体载体和权利要求 1 的式 I 化合物。

7. 权利要求 1 的式 I 化合物用于制备防治动物害虫或有害真菌的组组合物的用途。

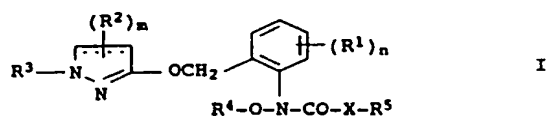
8. 一种防治有害真菌的方法,它包括用活性量的权利要求 1 的式 I 化合物处理有害真菌或欲免受真菌侵扰的材料、植物、土壤或种子。

9. 一种防治动物害虫的方法,它包括用活性量的权利要求 1 的式 I 化合物处理害虫或欲免受害虫侵扰的材料、植物、土壤或种子。

说明书

2-[(二氢)吡唑-3'-基氧亚甲基]苯胺的酰胺 及其制备方法和用途

本发明涉及式 I 的 2-[(二氢)吡唑-3'-基氧亚甲基]苯胺的酰胺



其中：— 为单键或双键，符号和取代基具有下列含义：

n 为 0、1、2、3 或 4，如果 n 大于 1，取代基 R^1 可以不相同；

m 为 0、1 或 2，如果 m 大于 1，取代基 R^2 可以不相同；

X 为直键、O 或 NR^6 ，其中的 R^6 为氢、烷基、链烯基、炔基、环烷基或环烯基；

R^1 为硝基、氰基、卤原子、未取代或取代的烷基、链烯基、炔基、烷氧基、链烯基氧基、炔基氧基，或者当 n 为 2 时，两个 R^1 还可以形成连接两个相邻环原子的未取代或取代的 3—4 元桥连基团，该桥连基团主链含有 3 或 4 个碳原子、或者含有 1—3 个碳原子和 1 或 2 个氮、氧和/或硫原子，它同与它们相连的环可形成部分不饱和或芳香基团；

R^2 为硝基、氰基、卤原子、 $C_1 - C_4$ 烷基、 $C_1 - C_4$ 卤代烷基、 $C_1 - C_4$ 烷氧基、 $C_1 - C_4$ 烷硫基或 $C_1 - C_4$ 烷氧基羰基；

R^3 为未取代或取代的烷基、链烯基或炔基；未取代或取代的饱和或者单不饱和或双不饱和环，该环除碳原子外还可含有 1—3 个下列杂原子作为环原子：氧、硫和氮；或者未取代或取代的单核或双核芳族基团，该芳族基团除碳原子外还可含有 1—4 个氮原子、或者 1 或 2 个氮原子和 1 个氧或硫原子、或者 1 个氧或硫原子作为环原子；

R^4 为氢, 未取代或取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烯基、烷基羰基或烷氧基羰基;

R^5 为烷基、链烯基、炔基、环烷基或环烯基, 或者当 X 为 NR^6 时, R^5 还可以是氢。

本发明还涉及制备这些化合物的方法和中间体, 含有它们的组合物以及它们用于防治动物害虫或有害真菌的用途。

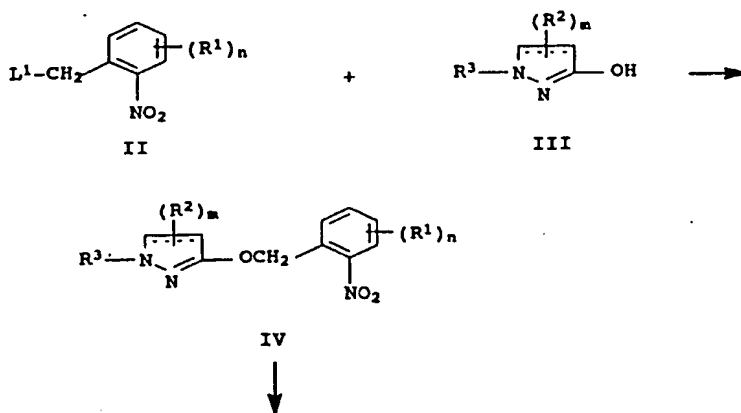
WO—A—93/15046 公开了用于防治动物害虫和有害真菌的 2—[吡啶基—4—氧亚甲基]苯胺的酰胺。

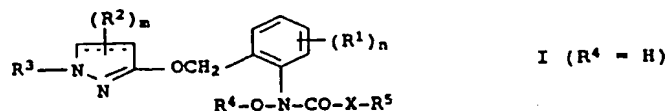
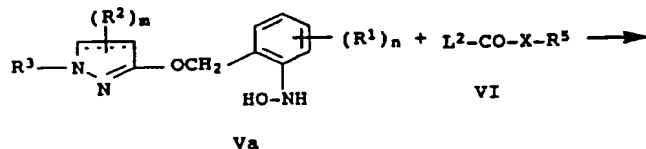
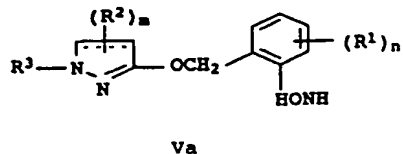
本发明的一个目的是提供具有改进活性的化合物。

我们发现这一目的已通过开头定义的化合物 I 达到。此外, 我们已找到了制备它们的方法和中间体、含有它们的混合物以及使用化合物 I 防治动物害虫和有害真菌的方法。

化合物 I 可由多种方法制备。

对于式中 R^4 为氢和 X 为直键或氧的化合物 I, 例如可如下制备: 在碱的存在下, 用式 III 的 3—羟基(二氢)吡啶将式 II 的苄基衍生物转化成相应的式 IV 所示 2—[(二氢)吡啶—3—基氧亚甲基]硝基苯, 然后将 IV 还原成式 Va 的 N—羟基苯胺, 并用式 VI 的羰基化合物将 Va 转化成 I。





式 II 中的 L^1 和式 VI 中的 L^2 为可被亲核置换的基团,例如卤原子,如氯、溴或碘,或烷基-或芳基磺酸酯,如甲基磺酸酯、三氟甲基磺酸酯、苯磺酸酯或 4-甲基苯磺酸酯。

化合物 II 和 III 的醚化反应通常在 0°C 至 80°C 下进行,优选为 20°C 至 60°C 。

适宜的溶剂为:芳香烃,例如甲苯,邻-、间-和对-二甲苯;卤代烃,例如二氯甲烷、氯仿和氯苯;醚,例如二乙基醚、二异丙基醚、叔丁基甲基醚、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃;腈,例如乙腈和丙腈;醇,例如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇和叔丁醇;酮,例如丙酮和甲基乙基酮;还有二甲亚砜、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、1,3-二甲基咪唑烷-2-酮和 1,2-二甲基四氢-2(1H)-嘧啶,优选二氯甲烷、丙酮、甲苯、叔丁基甲基醚和二甲基甲酰胺。还可使用上述溶剂的混合物。

适宜的碱一般为:无机化合物,如碱金属和碱土金属氢氧化物(如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾和氢氧化钙),碱金属和碱土金属

氧化物(如氧化锂、氧化钠、氧化钙和氧化镁),碱金属和碱土金属氢化物(如氢化锂、氢化钠、氢化钾和氢化钙),碱金属氮化物(如氨基锂、氨基钠和氨基钾),碱金属和碱土金属碳酸盐(如碳酸锂和碳酸钙),还有碱金属碳酸氢盐(如碳酸氢钠);有机金属化合物,尤其是碱金属烷基化物(如甲基锂、丁基锂和苯基锂),卤化烷基镁(如氯化甲基镁),还有碱金属和碱土金属醇盐(如甲醇钠、乙醇钠、乙醇钾、叔丁醇钾和二甲氧基镁);另外还有有机碱,如叔胺,例如三甲胺、三乙胺、三异丙基乙胺和 N-甲基吡啶、吡啶,取代的吡啶,例如可力丁、卢剔啶和 4-二甲基氨基吡啶以及二环胺。

尤其优选氢氧化钠、碳酸钾和叔丁醇钾。

碱通常以等摩尔量、过量使用,或者(如果适宜)则作为溶剂使用。

加入催化量的冠醚(如 18-冠-6 或 15-冠-5)对于反应可能是有利的。

反应还可在由碱金属或碱土金属氢氧化物或碳酸盐的水溶液和有机相(如芳香烃和/或卤代烃)组成的两相体系中进行。在这种情况下,适宜的相转移催化剂例如为:卤化铵和四氟硼酸铵(如氟化苄基三乙基铵、溴化苄基三丁基铵、氯化四丁基铵、溴化十六烷基三甲基铵或四氟硼酸四丁基铵)以及卤化鏻(如四丁基氯化鏻和四苯基溴化鏻)。

首先用碱将 3-羟基(二氢)吡唑转化成相应的羟基化物,接着与苄基衍生物反应对于反应可能是有利的。

制备化合物 I 所需的起始物 II 公开在 EP-A 513 580 中或可用已知方法制备[《合成化学》(Synthesis) 1991, 181; Anal. Chim. Acta 185 (1986), 295; EP-A 336 567]

3-羟基吡唑 IIIa 或 3-羟基二氢吡唑 IIIb 同样是已知的或可用已知方法制备[IIIa:《杂环化学杂志》(J. Heterocycl. Chem.) 30 (1993), 49;《化学通讯》(Chem. Ber.) 107 (1974), 1318;《化学药物通讯》(Chem. Pharm. Bull. 19 (1971), 1389;《四面体通讯》(Tetrahedron Lett.) 11 (1970), 875;《杂环化合物化学》(Chem. Herte-

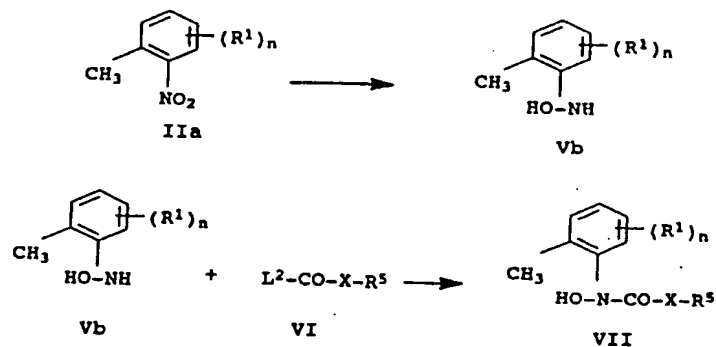
rocycl. Comp.) 5 (1969), 527; 《化学通讯》 102 (1969), 3260; 《化学通讯》 109 (1976), 261; 《有机化学杂志》 (J. Org. Chem.) 31 (1966), 1538; 《四面体通讯》 43 (1987), 607. IIIb: 《医用化学杂志》 (J. Med. Chem.) 19 (1976), 715].

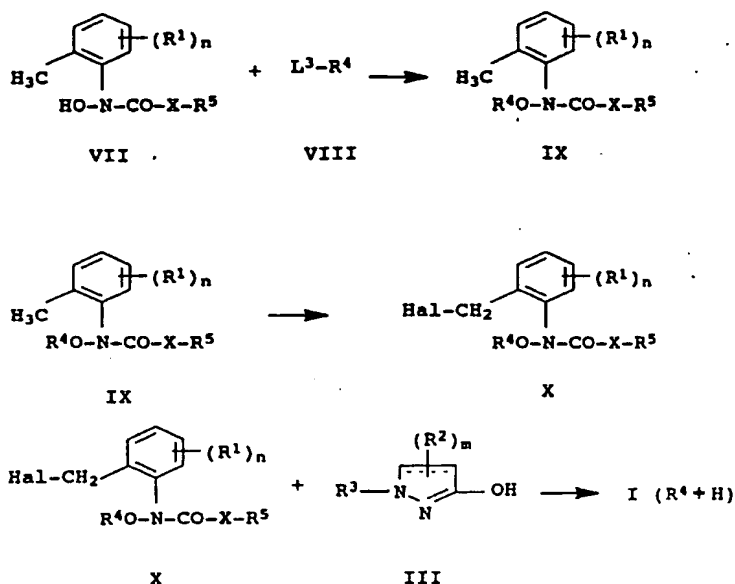
特别优选的是, 用德国专利申请 No. 415 484.4 中公开的方法制备 3-羟基吡唑 IIIa。

以类似于已知方法的方式将硝基化合物 IV 还原成相应的 N-羟基苯胺 Va, 例如使用金属如锌 [参见 Ann. Chem. 316 (1901), 278] 或者氢气 (参见 EP-A 085 890)。

根据前述化合物 II 与 3-羟基(二氢)吡唑 III 反应的条件, 在碱性条件下使 N-羟基苯胺 Va 与羰基化合物 VI 反应。该反应优选在 -10°C 至 30°C 进行。优选的溶剂是二氟甲烷、甲苯、叔丁基甲基醚或乙酸乙酯。优选的碱是碳酸氢钠、碳酸钾或氢氧化钠水溶液。

式中 X 是直键或氧的式 I 化合物例如还可如下制备: 首先将苄基衍生物 IIa 还原成相应的羟基苯胺 Vb, 用羰基化合物 VI 将 Vb 转化成相应的苯胺酰胺 VII, 然后用化合物 VIII 将 VII 转化成酰胺 IX, 随后将 IX 转化成相应的苄基卤化物 X, 在碱的存在下用式 III 的 3-羟基(二氢)吡唑将 X 转化成 I。





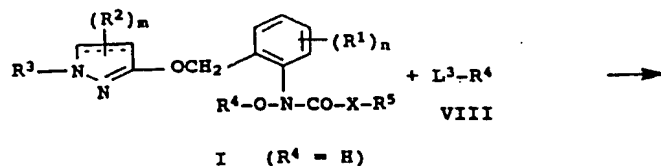
式 X 中, Hal 为卤原子, 特别是氯或溴。

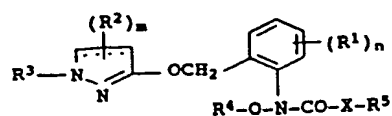
式 VIII 中的 L^3 是可被亲核置换的基团, 例如卤(如氯、溴或碘)或者烷基或芳基磺酸酯(如甲基磺酸酯、三氟甲基磺酸酯、苯磺酸酯或 4-甲基苯磺酸酯), R^4 不是氢原子。

该反应以类似于前述反应的方式进行。

使用自由基将化合物 IX 卤化, 可以使用卤化试剂, 例如 N-氯代或 N-溴代琥珀酰亚胺、元素卤(如氯或溴)或亚硫酸氯、磺酰氯、三氯化磷或五氯化磷及类似化合物。另外还使用自由基引发剂(如偶氮双异丁腈), 或者反应在辐射(用 UV 线)下进行。卤化反应以已知方式在常规有机溶剂中进行。

式中 R^4 不为氢的化合物 I 还可以通过使式中 R^4 为氢的相应化合物 I 与化合物 VIII 反应得到。



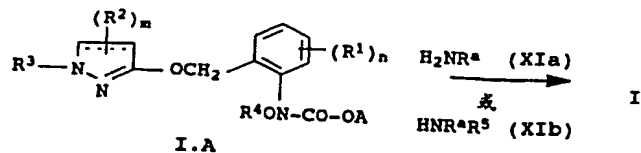
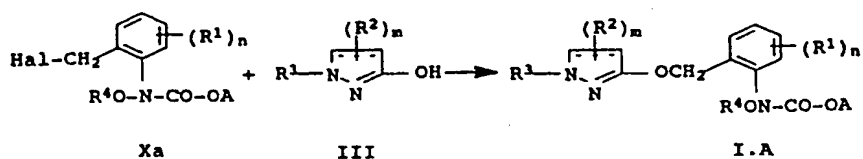
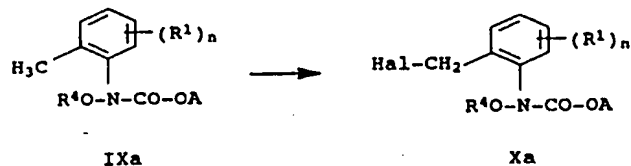
I (R^4+H)

该反应以已知方式在碱的存在下、在惰性溶剂中和 0°C — 50°C 进行。

使用的碱优选碳酸氢钠、碳酸钾、氢氧化钠和氢氧化钠水溶液。

使用的溶剂优选丙酮、二甲基甲酰胺、甲苯、叔丁基甲基醚、乙酸乙酯和甲醇。

式中 X 为 NR^5 的化合物 I 优选如下所述制备：将甲基苯胺的酰胺 IXa 转化成相应的苄基卤化物 Xa，在碱的存在下用 3-羟基(二氢)吡唑将 Xa 转化成 I.A，然后使 I.A 与伯胺或仲胺 XI 反应生成 I。



式 VIIa 中, A 是烷基(特别是 C_1-C_6 烷基)或苯基。式 VIIIa 中的 Hal 是卤(特别是氯或溴)原子。

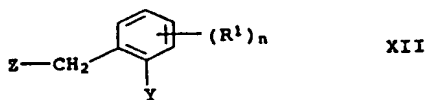
IXa 转化为 Xa 或者 Xa 转化为 I.A 的反应的一般和优选条件如前所述。

化合物 I.A 与伯胺 XIa 或仲胺 XIb 的反应在 $0^\circ\text{C}-100^\circ\text{C}$ 、在惰性溶剂或溶剂混合物中进行。

适宜的溶剂特别是水、叔丁基甲基醚和甲苯或它们的混合物。为改进原料的溶解性, 优选再加入一种下列溶剂(作为溶解剂): 四氢呋喃, 甲醇, 二甲基甲酰胺, 和乙二醇醚。

基于化合物 X, 通常使用过量的胺 XIa 和 XIb, 至多可过量 100%, 或者用作溶剂。考虑到产率, 优选在加压下进行反应。

制备式 I 化合物时经过式 XII 的中间体



式中的取代基和符号具有下述含义:

n 为 0、1、2、3 或 4, 如果 n 大于 1, 取代基 R^1 可以不相同;

R^1 为硝基, 氰基, 卤原子, 未取代或取代的烷基、链烯基、炔基、烷氧基、链烯基氧基、炔基氧基, 或者 n 为 2 时, 两个 R^1 还可以形成连接两个相邻环原子的未取代或取代的 3—4 元桥连基团, 该桥连基团主链含有 3 或 4 个碳原子、或者 1—3 个碳原子和 1 或 2 个氮、氧和/或硫原子, 它同与它们相连的环可形成部分不饱和或芳香基团;

Y 为 NO_2 、 NHOH 或 NHOR^4 , 其中的 R^4 为未取代或取代的烷基、链烯基、炔基、环烷基、环烯基、烷基羰基或烷氧基羰基;

Z 为氢, 羟基, 巯基, 氰基, 硝基, 卤原子, C_1-C_6 烷基磺酰基, 未取代或取代的芳基磺酰基, 或是基团 Z^a



式中

·m 为 0、1 或 2, 如果 m 大于 1, 取代基 R^2 可以不相同;

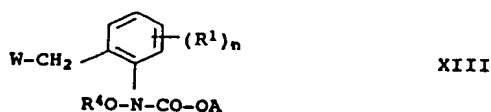
· R^2 为硝基、氨基、卤原子、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基或 C_1-C_4 烷氧基羰基;

· R^3 为未取代或取代的烷基、链烯基或炔基; 未取代或取代的饱和或者单不饱和或双不饱和环, 该环除碳原子外还可含有 1—3 个下列杂原子作为环原子: 氧、硫和氮; 或者未取代或取代的单核或双核芳族基团, 该芳族基团除碳原子外还可含有 1—4 个氮原子、或者 1 或 2 个氮原子和 1 个氧或硫原子、或者 1 个氧或硫原子作为环原子。

在制备时, 特别优选式中 Y 为 $NHOH$ 和 Z 为基团 Z^a 的式 XII 所示中间体。

此外, 也优选式中 Y 为 NO_2 和 Z 为基团 Z^a 的式 IX 所示中间体。

在制备式中 X 为 NR^a 的化合物 I 时, 优选式 XIII 的中间体



式中: 取代基 R^1 和 R^4 以及符号 n 的意义如前所述;

W 为氢、卤原子或 Z^a ; 和

A 为烷基或苯基。

在此情况下, 特别优选式中 W 为氢、氯、溴或 Z^a 的化合物 XIII。

此外, 也优选式中 A 为 C_1-C_6 烷基的化合物 XIII。

也特别优选式中 A 为苯基的化合物 XIII。

同样优选式中 R^4 为氢、甲基或乙基的化合物 XIII。

此外, 优选式中 n 为 0 或 1 的化合物 XIII。

特别优选式中的取代基和符号具有下述含义的化合物 XIII:

n 为 0,

W 为氢、氟、溴或 Z^a ,

R^4 为氢、甲基或乙基, 和

A 为苯基。

化合物 I 可含有酸性或碱性中心, 因此可形成酸加成产物或碱加成产物或盐。

用于形成酸加成产物的酸主要有无机酸(例如, 氢卤酸如氢氟酸和氢溴酸, 磷酸, 硫酸, 硝酸)、有机酸(例如甲酸、乙酸、草酸、丙二酸、乳酸、苹果酸、琥珀酸、酒石酸、柠檬酸、水杨酸、对甲苯磺酸、十二烷基苯磺酸)或其它质子酸(如糖精)。用于形成碱加成产物的碱主要有碱金属或碱土金属的氧化物、氢氧化物、碳酸盐或碳酸氢盐(如钠或钾的氢氧化物或碳酸盐)或铵化合物(如氢氧化铵)。

在上式所给的符号的定义中, 采用的集合术语通常表示下列取代基:

卤素原子: 氟、氯、溴和碘;

烷基: 具有 1 至 4 或 10 个碳原子的饱和直链或支链烷基, 如甲基、乙基、丙基、1-甲基-乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基和 1,1-二甲基乙基;

卤代烷基: 具有 1 至 4 个碳原子的直链或支链烷基(如上所述), 该基团上的氢原子可部分或全部被如上所述的卤原子置换, 例如: C_1 - C_2 -卤代烷基, 如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氟氟甲基、二氟一氟甲基、一氟二氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氟-2-氟乙基、2-氟-2,2-二氟乙基、2,2-二氟-2-氟乙基、2,2,2-三氟乙基和五氟乙基;

烷基羰基: 通过羰基($-CO-$)与主结构相连的直链或支链烷基, 特别是 C_1 - C_{10} 烷基(如上所述);

烷氧基: 具有 1 至 4 或 10 个碳原子的直链或支链烷基(如上所述), 它借助于氧原子($-O-$)连接到主体结构上;

烷氧基羰基:具有1至4个碳原子的直链或支链烷氧基(如上所述),它借助于羰基($-\text{CO}-$)连接到主体结构上;

烷硫基:具有1至4个碳原子的直链或支链烷基(如上所述),它借助于硫原子($-\text{S}-$)连接到主体结构上;

未取代或取代的烷基:饱和直链或支链烷基,尤其是具有1至10个碳原子的烷基,例如 C_1-C_6 烷基,如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基和1-乙基-2-甲基丙基;

未取代或取代的链烯基:不饱和直链或支链烷基,尤其是具有2至10个碳原子、双键位于任何所需位置的链烯基,例如 C_2-C_6 链烯基,如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-

3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基和1-乙基-2-甲基-2-丙烯基；

未取代或取代的链烯基氧基：通过氧原子与主结构相连的直链或支链 C_3-C_{10} 链烯基(如上所述)；

炔基：直链或支链炔基，尤其是具有2至20个碳原子、叁键位于任何所需位置的炔基，例如 C_2-C_6 炔基，如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基和1-乙基-1-甲基-2-丙炔基；

未取代或取代的炔基氧基：通过氧原子(—O—)与主结构相连的直链或支链 C_3-C_{10} 炔基(如前所述)；

未取代或取代的环烷基： C_3-C_{10} 单环或双环烷基，例如 C_3-C_{10} (双)环烷基，如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、冰片烷基、降冰片烷基、二环己基、双环[3.3.0]辛基、双环[3.2.1]辛基、双环

[2.2.2]辛基或双环[3.3.1]壬基;

未取代或取代的环烯基:双键处于任何所需环上位置的 C_5 — C_{10} 单环或双环烯基,例如 C_5 — C_{10} (双)环烯基,如环戊烯基、环己烯基、环庚烯基、冰片烯基、降冰片烯基、二环己烯基和双环[3.3.0]辛烯基;

连接两个相邻环原子的未取代或取代的 3—4 元桥连基团,该桥连基团主链含有 3 或 4 个碳原子、或者含有 1—3 个碳原子和 1 或 2 个氮、氧和/或硫原子,它同与它们相连的环可形成部分不饱和或芳香基团:例如同与它们相连的环形成一个下述环系的桥连基团:噻啉基、苯并呋喃基或萘基;

未取代或取代的饱和或者单不饱和或双不饱和环,它除碳原子外还可含有 1—3 个下列杂原子作为环原子:氧、硫和氮,例如:碳环,如环丙基、环戊基、环己基、环戊-2-烯基、环己-2-烯基;5 至 6 元饱和或不饱和杂环,它含有 1—3 个氮原子和/或 1 个氧或硫原子,如 2-四氢呋喃基、3-四氢呋喃基、2-四氢噻吩基、3-四氢噻吩基、2-吡咯烷基、3-吡咯烷基、3-异噁唑烷基、4-异噁唑烷基、5-异噁唑烷基、3-异噻唑烷基、4-异噻唑烷基、5-异噻唑烷基、3-吡唑烷基、4-吡唑烷基、5-吡唑烷基、2-噁唑烷基、4-噁唑烷基、5-噁唑烷基、2-噻唑烷基、4-噻唑烷基、5-噻唑烷基、2-咪唑烷基、4-咪唑烷基、1,2,4-噁二唑烷-3-基、1,2,4-噁二唑烷-5-基、1,2,4-噻二唑烷-3-基、1,2,4-噻二唑烷-5-基、1,2,4-三唑烷-3-基、1,3,4-噁二唑烷-2-基、1,3,4-噻二唑烷-2-基、1,3,4-三唑烷-2-基、2,3-二氢呋喃-2-基、2,3-二氢呋喃-3-基、2,4-二氢呋喃-2-基、2,4-二氢呋喃-3-基、2,3-二氢噻吩-2-基、2,3-二氢噻吩-3-基、2,4-二氢噻吩-2-基、2,4-二氢噻吩-3-基、2,3-吡咯啉-2-基、2,3-吡咯啉-3-基、2,4-吡咯啉-2-基、2,4-吡咯啉-3-基、2,3-异噁唑啉-3-基、3,4-异噁唑啉-3-基、4,5-异噁唑啉-3-基、2,3-异噁唑啉-4-基、3,4-异噁唑啉-4-基、4,5-异噁唑啉-4-基、2,3-异噁唑啉-5-基、3,4-异噁唑啉-5-基、4,5-异噁唑啉-

啉-5-基、2,3-异噻唑啉-3-基、3,4-异噻唑啉-3-基、4,5-异噻唑啉-3-基、2,3-异噻唑啉-4-基、3,4-异噻唑啉-4-基、4,5-异噻唑啉-4-基、2,3-异噻唑啉-5-基、3,4-异噻唑啉-5-基、4,5-异噻唑啉-5-基、2,3-二氢吡唑-1-基、2,3-二氢吡唑-2-基、2,3-二氢吡唑-3-基、2,3-二氢吡唑-4-基、2,3-二氢吡唑-5-基、3,4-二氢吡唑-1-基、3,4-二氢吡唑-3-基、3,4-二氢吡唑-4-基、3,4-二氢吡唑-5-基、4,5-二氢吡唑-1-基、4,5-二氢吡唑-3-基、4,5-二氢吡唑-4-基、4,5-二氢吡唑-5-基、2,3-二氢噁唑-2-基、2,3-二氢噁唑-3-基、2,3-二氢噁唑-4-基、2,3-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、3,4-二氢噁唑-5-基、2-哌啶基、3-哌啶基、4-哌啶基、1,3-二噁烷-5-基、2-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基、2-四氢噻吩基、3-四氢噻吩基、4-四氢噻吩基、2-四氢嘧啶基、4-四氢嘧啶基、5-四氢嘧啶基、2-四氢吡嗪基、1,3,5-四氢三嗪-2-基和1,2,4-四氢三嗪-3-基, 优选2-四氢呋喃基、2-四氢噻吩基、2-吡咯烷基、3-异噻唑烷基、3-异噻唑烷基、1,3,4-噁唑烷-2-基、2,3-二氢噻吩-2-基、4,5-异噻唑啉-3-基、3-哌啶基、1,3-二噁烷-5-基、4-哌啶基、2-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基;

未取代或取代的单核或双核芳香环体系, 它除碳原子外还可含有1—4个氮原子、或者1或2个氮原子和1个氧或硫原子、或者1个氧或硫原子作为环原子, 例如: 芳基, 例如苯基和萘基, 优选苯基或者1-或2-萘基; 和杂芳基, 如含有1—3个氮原子和/或1个氧或硫原子的5元环杂芳族化合物, 如2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-

5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,2,5-三唑-3-基、1,2,3-三唑-4-基、1,2,3-三唑-5-基、1,2,3-三唑-4-基、5-四唑基、1,2,3,4-噻三唑-5-基和1,2,3,4-噻三唑-5-基,尤其是3-异噻唑基、5-异噻唑基、4-噻唑基、4-噻唑基、1,3,4-噻二唑-2-基和1,3,4-噻三唑-2-基;或含有1—4个氮原子作为杂原子的6元环杂芳族化合物,如2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基和1,2,4,5-四嗪-3-基,尤其是2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、2-吡嗪基和4-哒嗪基。

对于烷基、链烯基和炔基,未取代或取代的定义意味着这些基团可被部分或全部卤代(即这些基团中的氢原子可部分或全部被例如相同或不同的上面提到的卤原子置换,优选氟、氯和溴,尤其是氟和氯)和/或可带有1—3个、尤其是1个下列基团:

C_1-C_6 烷氧基, C_1-C_6 卤代烷氧基, C_1-C_6 烷硫基, C_1-C_6 卤代烷硫基, C_1-C_6 烷基氨基, 二(C_1-C_6 烷基)氨基, C_2-C_6 链烯基氧基, C_2-C_6 卤代链烯基氧基, C_2-C_6 炔基氧基, C_2-C_6 卤代炔基氧基, C_3-C_6 环烷基, C_3-C_6 环烷基氧基, C_3-C_6 环烯基, C_3-C_6 环烯基氧基;或者

如上所述的未取代或取代的单核或双核芳环体系,它除碳原子外还可含有1—4个氮原子、或者1或2个氮原子和1个氧或硫原子、或者1个氧或硫原子作为环原子,它可直接或者通过氧原子(—O—)、硫原子(—S—)或氨基(—NR^a—)与前述取代基相连,即:芳基,例如苯基和萘基,优选苯基或1-或2-萘基;和杂芳基,例如含有1—3个氮原子和/或1个氧或硫原子的5元环杂芳基,如2-咪唑基、3-咪唑基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,2,4-噻二唑-3-

基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,2,5-三唑-3-基、1,2,3-三唑-4-基、1,2,3-三唑-5-基、1,2,3-三唑-4-基、5-四唑基、1,2,3,4-噻三唑-5-基和1,2,3,4-噁三唑-5-基,尤其是3-异噁唑基、5-异噁唑基、4-噁唑基、4-噻唑基、1,3,4-噁二唑-2-基和1,3,4-噻二唑-2-基;或含有1—4个氮原子作为杂原子的6元环杂芳基,如2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基和1,2,4,5-四嗪-3-基,尤其是2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、2-吡嗪基和4-哒嗪基。

基团中提到的单核或双核芳族或杂芳族体系又可被部分或全部卤代,即这些基团的氢原子可部分或全部被例如氟、氯、溴和碘的卤原子置换,优选氟和氯。

除上述卤原子外,这些单核或双核芳族或杂芳族体系可带有1—3个下列取代基:

硝基;

氰基、氰硫基;

烷基,尤其是如上所述的 C_1-C_6 烷基,优选甲基、乙基、1-甲基乙基、1,1-二甲基乙基、丁基、己基,尤其是甲基和1-甲基乙基;

如上所述的 C_1-C_4 卤代烷基,优选三氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基和五氟乙基;

C_1-C_4 烷氧基,优选甲氧基、乙氧基、1-甲基乙氧基和1,1-二甲基乙氧基,尤其是甲氧基;

C_1-C_4 卤代烷氧基,尤其是 C_1-C_2 卤代烷氧基,优选二氟甲氧基、三氟甲氧基和2,2,2-三氟乙氧基,尤其是二氟甲氧基;

C_1-C_4 烷硫基,优选甲硫基和1-甲基乙硫基,尤其是甲硫基;

C_1-C_4 烷基氨基,例如甲氨基、乙氨基、丙氨基、1-甲基乙氨基、丁氨基、1-甲基丙氨基、2-甲基丙氨基和1,1-二甲基乙氨基,优选甲氨基和1,1-二甲基乙氨基,尤其是甲氨基;

二(C_1-C_4 烷基)氨基,例如N,N-二甲基氨基、N,N-二乙基

氨基, N,N-二丙基氨基、N,N-二(1-甲基乙基)氨基、N,N-二丁基氨基、N,N-二(1-甲基丙基)氨基、N,N-二(2-甲基丙基)氨基、N,N-二(1,1-二甲基乙基)氨基、N-乙基-N-甲基氨基、N-甲基-N-丙基氨基、N-甲基-N-(1-甲基乙基)氨基、N-丁基-N-甲基氨基、N-甲基-N-(1-甲基丙基)氨基、N-甲基-N-(2-甲基丙基)氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基氨基、N-乙基-N-丙基氨基、N-乙基-N-(1-甲基乙基)氨基、N-丁基-N-乙基氨基、N-乙基-N-(1-甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(2-甲基丙基)氨基、N-乙基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基、N-(1-甲基乙基)-N-丙基氨基、N-丁基-N-丙基氨基、N-(1-甲基丙基)-N-丙基氨基、N-(2-甲基丙基)-N-丙基氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-丙基氨基、N-丁基-N-(1-甲基乙基)氨基、N-(1-甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基、N-(1-甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基乙基)氨基、N-丁基-N-(1-甲基丙基)氨基、N-丁基-N-(2-甲基丙基)氨基、N-丁基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基、N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)氨基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基和 N-(1,1-二甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基, 优选 N,N-二甲基氨基和 N,N-二乙基氨基, 尤其是 N,N-二甲基氨基;

C₁-C₆ 烷基羰基, 例如甲基羰基、乙基羰基、丙基羰基、1-甲基乙基羰基、丁基羰基、1-甲基丙基羰基、2-甲基丙基羰基、1,1-二甲基乙基羰基、戊基羰基、1-甲基丁基羰基、2-甲基丁基羰基、3-甲基丁基羰基、1,1-二甲基丙基羰基、1,2-二甲基丙基羰基、2,2-二甲基丙基羰基、1-乙基丙基羰基、己基羰基、1-甲基戊基羰基、2-甲基戊基羰基、3-甲基戊基羰基、4-甲基戊基羰基、1,1-二甲基丁基羰基、1,2-二甲基丁基羰基、1,3-二甲基丁基羰基、2,2-二甲基丁基羰基、2,3-二甲基丁基羰基、3,3-二甲基丁基羰基、1-乙基丁基羰基、2-乙基丁基羰基、1,1,2-三甲基丙基羰基、1,2,2-三甲基丙基羰基、1-乙基-1-甲基丙基羰基和 1-乙基-2-甲基丙基-

羰基, 优选甲基羰基、乙基羰基和 1,1-二甲基羰基, 尤其是乙基羰基;

C_1-C_6 烷氧基羰基, 例如甲氧基羰基、乙氧基羰基、丙氧基羰基、1-甲基乙氧基羰基、丁氧基羰基、1-甲基丙氧基羰基、2-甲基丙氧基羰基、1,1-二甲基乙氧基羰基、戊氧基羰基、1-甲基丁氧基羰基、2-甲基丁氧基羰基、3-甲基丁氧基羰基、2,2-二甲基丙氧基羰基、1-乙基丙氧基羰基、己氧基羰基、1,1-二甲基丙氧基羰基、1,2-二甲基丙氧基羰基、1-甲基戊氧基羰基、2-甲基戊氧基羰基、3-甲基戊氧基羰基、4-甲基戊氧基羰基、1,1-二甲基丁氧基羰基、1,2-二甲基丁氧基羰基、1,3-二甲基丁氧基羰基、2,2-二甲基丁氧基羰基、2,3-二甲基丁氧基羰基、3,3-二甲基丁氧基羰基、1-乙基丁氧基羰基、2-乙基丁氧基羰基、1,1,2-三甲基丙氧基羰基、1,2,2-三甲基丙氧基羰基、1-乙基-1-甲基丙氧基羰基和 1-乙基-2-甲基-丙氧基羰基, 优选甲氧基羰基、乙氧基羰基和 1,1-二甲基乙氧基羰基, 尤其是乙氧基羰基;

C_1-C_6 烷基氨基羰基, 例如甲氨基羰基、乙氨基羰基、丙氨基羰基、1-甲基乙氨基羰基、丁氨基羰基、1-甲基丙氨基羰基、2-甲基丙氨基羰基、1,1-二甲基乙氨基羰基、戊氨基羰基、1-甲基丁氨基羰基、2-甲基丁氨基羰基、3-甲基丁氨基羰基、2,2-二甲基丙氨基羰基、1-乙基丙氨基羰基、己氨基羰基、1,1-二甲基丙氨基羰基、1,2-二甲基丙氨基羰基、1-甲基戊氨基羰基、2-甲基戊氨基羰基、3-甲基戊氨基羰基、4-甲基戊氨基羰基、1,1-二甲基丁氨基羰基、1,2-二甲基丁氨基羰基、1,3-二甲基丁氨基羰基、2,2-二甲基丁氨基羰基、2,3-二甲基丁氨基羰基、3,3-二甲基丁氨基羰基、1-乙基丁氨基羰基、2-乙基丁氨基羰基、1,1,2-三甲基丙氨基羰基、1,2,2-三甲基丙氨基羰基、1-乙基-1-甲基丙氨基羰基和 1-乙基-2-甲基丙氨基羰基, 优选甲氨基羰基和乙氨基羰基, 尤其是甲氨基羰基;

二(C_1-C_6 烷基)氨基羰基, 尤其是二(C_1-C_4 -烷基)氨基羰基, 例如 N,N-二甲基氨基羰基、N,N-二乙基氨基羰基、N,N-二

丙基氨基羧基、N,N-二(1-甲基乙基)氨基羧基、N,N-二丁基氨基羧基、N,N-二(1-甲基丙基)氨基羧基、N,N-二(2-甲基丙基)氨基羧基、N,N-二(1,1-二甲基乙基)氨基羧基、N-乙基-N-甲基氨基羧基、N-甲基-N-丙基氨基羧基、N-甲基-N-(1-甲基乙基)氨基羧基、N-丁基-N-甲基氨基羧基、N-甲基-N-(1-甲基丙基)氨基羧基、N-甲基-N-(2-甲基丙基)氨基羧基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-甲基氨基羧基、N-乙基-N-丙基氨基羧基、N-乙基-N-(1-甲基乙基)氨基羧基、N-丁基-N-乙基氨基羧基、N-乙基-N-(1-甲基丙基)氨基羧基、N-乙基-N-(2-甲基丙基)氨基羧基、N-乙基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基羧基、N-(1-甲基乙基)-N-丙基氨基羧基、N-丁基-N-丙基氨基羧基、N-(1-甲基丙基)-N-丙基氨基羧基、N-(2-甲基丙基)-N-丙基氨基羧基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-丙基氨基羧基、N-丁基-N-(1-甲基乙基)-氨基羧基、N-(1-甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基羧基、N-(1-甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基羧基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基乙基)氨基羧基、N-丁基-N-(1-甲基丙基)氨基羧基、N-丁基-N-(2-甲基丙基)氨基羧基、N-丁基-N-(1,1-二甲基乙基)氨基羧基、N-(1-甲基丙基)-N-(2-甲基丙基)氨基羧基、N-(1,1-二甲基乙基)-N-(1-甲基丙基)氨基羧基和N-(1,1-二甲基乙基)-N-(2-甲基丙基)氨基羧基,优选N,N-二甲基氨基羧基和N,N-二乙基氨基羧基,尤其是N,N-二甲基氨基羧基;

C₁-C₆烷基羧基,例如甲基羧基、乙基羧基、丙基羧基、1-甲基乙基羧基、丁基羧基、1-甲基丙基羧基、2-甲基丙基羧基、1,1-二甲基乙基羧基、戊基羧基、1-甲基丁基羧基、2-甲基丁基羧基、3-甲基丁基羧基、1,1-二甲基丙基羧基、1,2-二甲基丙基羧基、2,2-二甲基丙基羧基、1-乙基丙基羧基、己基羧基、1-甲基戊基羧基、2-甲基戊基羧基、3-甲基戊基羧基、4-甲基戊基羧基、1,1-二甲基丁基羧基、1,2-二甲基丁基羧基、1,3-二甲基丁基羧基、2,2-二甲基丁基羧基、2,3-二甲基丁基羧基、3,3-二甲基丁基羧基、1-乙基

丁基羧基、2-乙基丁基羧基、1,1,2-三甲基丙基羧基、1,2,2-三甲基丙基羧基、1-乙基-1-甲基丙基羧基和1-乙基-2-甲基丙基羧基,优选甲基羧基、乙基羧基和1,1-二甲基乙基羧基,尤其是甲基羧基和1,1-二甲基乙基羧基;

C_1-C_6 烷基羰基氨基,例如甲基羰基氨基、乙基羰基氨基、丙基羰基氨基、1-甲基乙基羰基氨基、丁基羰基氨基、1-甲基丙基羰基氨基、2-甲基丙基羰基氨基、1,1-二甲基乙基羰基氨基、戊基羰基氨基、1-甲基丁基羰基氨基、2-甲基丁基羰基氨基、3-甲基丁基羰基氨基、2,2-二甲基丙基羰基氨基、1-乙基丙基羰基氨基、己基羰基氨基、1,1-二甲基丙基羰基氨基、1,2-二甲基丙基羰基氨基、1-甲基戊基羰基氨基、2-甲基戊基羰基氨基、3-甲基戊基羰基氨基、4-甲基戊基羰基氨基、1,1-二甲基丁基羰基氨基、1,2-二甲基丁基羰基氨基、1,3-二甲基丁基羰基氨基、2,2-二甲基丁基羰基氨基、2,3-二甲基丁基羰基氨基、3,3-二甲基丁基羰基氨基、1-乙基丁基羰基氨基、2-乙基丁基羰基氨基、1,1,2-三甲基丙基羰基氨基、1,2,2-三甲基丙基羰基氨基、1-乙基-1-甲基丙基羰基氨基和1-乙基-2-甲基丙基羰基氨基,优选甲基羰基氨基和乙基羰基氨基,尤其是乙基羰基氨基;

C_3-C_7 环烷基,例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基和环庚基,优选环丙基、环戊基和环己基,尤其是环丙基;

C_3-C_7 环烷氧基,例如环丙氧基、环丁氧基、环戊氧基、环己氧基和环庚氧基,优选环戊氧基和环己氧基,尤其是环己氧基;

C_3-C_7 环烷硫基,例如环丙硫基、环丁硫基、环戊硫基、环己硫基和环庚硫基,优选环己硫基;

C_3-C_7 环烷基氨基,例如环丙氨基、环丁氨基、环戊氨基、环己氨基和环庚氨基,优选环丙氨基和环己氨基,尤其是环丙氨基。

除上述取代基外,单核或双核芳族或杂芳族体系还可带有基团— $CR' = NOR''$,其中

R' 为氢、氟基、烷基(优选 C_1-C_6 烷基、特别是 C_1-C_4 烷基)、

卤代烷基(优选 C_1-C_4 卤代烷基、特别是 C_1-C_2 卤代烷基)、链烯基(优选 C_2-C_6 链烯基、特别是 C_2-C_4 链烯基)、卤代链烯基(优选 C_2-C_6 卤代链烯基、特别是 C_2-C_4 卤代链烯基)、炔基(优选 C_2-C_6 炔基、特别是 C_2-C_4 炔基)、卤代炔基(优选 C_2-C_6 卤代炔基、特别是 C_2-C_4 卤代炔基)和环烷基(优选 C_3-C_8 环烷基、特别是 C_3-C_6 环烷基);

R'' 为烷基(优选 C_1-C_6 烷基、特别是 C_1-C_4 烷基)、卤代烷基(优选 C_1-C_4 卤代烷基、特别是 C_1-C_2 卤代烷基)、链烯基(优选 C_2-C_6 链烯基、特别是 C_2-C_4 链烯基)、卤代链烯基(优选 C_2-C_6 卤代链烯基、特别是 C_2-C_4 卤代链烯基)、炔基(优选 C_2-C_6 炔基、特别是 C_2-C_4 炔基)、卤代炔基(优选 C_2-C_6 卤代炔基、特别是 C_2-C_4 卤代炔基)和环烷基(优选 C_3-C_8 环烷基、特别是 C_3-C_6 环烷基);

考虑到它们的生理活性, 优选式中 \equiv 为双键的化合物 I。

此外, 优选式中 \equiv 为单键的化合物 I。

同样, 优选式中 n 为 0 或 1、尤其是 0 的化合物 I。

另外, 优选式中 R^1 为卤原子、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_2 卤代烷氧基的化合物 I。

此外, 优选式中 m 为 0 或 1 的化合物 I。

同样, 优选式中 R^2 为硝基、卤原子、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 烷氧基羰基的化合物 I。

此外, 优选式中 R^3 为 C_1-C_4 烷基或 C_3-C_6 环烷基的化合物 I。

此外, 优选式中 R^3 为未取代或取代的单核或双核芳基(该芳基除碳原子外还可含有 1—4 个氮原子、或者 1 或 2 个氮原子和 1 个氧或硫原子、或者 1 个氧或硫原子作为环原子)的化合物 I。

特别是, 优选式中 R^3 为苯基或苄基的化合物 I, 其中的苯环可被部分或完全卤代和/或带有

— 1—3 个下列基团: 氰基, 硝基, C_1-C_6 烷基, C_1-C_4 卤代烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 卤代烷氧基, C_1-C_4 烷氧基— C_1-C_4 烷

基, C_3-C_6 环烷基, C_1-C_4 烷基羰基, C_1-C_4 烷氧基羰基, 苯基, 苯氧基和苯基- C_1-C_4 烷氧基, 这些基团中的苯环又可被部分或全部卤代和/或带有 1—3 个下列基团: 氰基, 硝基, C_1-C_4 烷基, C_1-C_2 卤代烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_2 卤代烷氧基, C_3-C_6 环烷基, C_1-C_4 烷基羰基或 C_1-C_4 烷氧基羰基, 和/或

—基团 $CR' = NOR''$, 其中的 R' 为氢或 C_1-C_4 烷基, R'' 为 C_1-C_6 烷基, 和/或

—连接苯环上两个相邻 C 原子的氧基- C_1-C_3 烷氧基或氧基- C_1-C_3 卤代烷氧基的桥连基团。

此外, 特别优选式中 R^3 为吡啶基或嘧啶基的化合物 I, 其中的吡啶环可被部分或完全卤代和/或带有 1—3 个下列基团: 氰基, 硝基, C_1-C_4 烷基, C_1-C_2 卤代烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_2 卤代烷氧基, C_3-C_6 环烷基, C_1-C_4 烷基羰基或 C_1-C_4 烷氧基羰基。

此外, 优选式中 R^4 为氢、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_2 卤代烷基的化合物 I。

此外, 优选式中 R^5X 为甲基、乙基、甲氧基或甲氨基的化合物 I。

特别优选的化合物 I 收集于下列表中。

表 1

通式 I.1 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲基, 和 P_p^x 为表 A 中的一行所示取代基

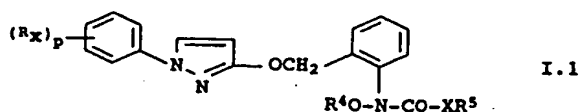


表 2

通式 I.1 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为乙基, 和 P_p^x 为表 A 中的一行所示取代基

表 3

通式 I.2 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲基, 和 P_p^x 为表 A 中的一行所示取代基

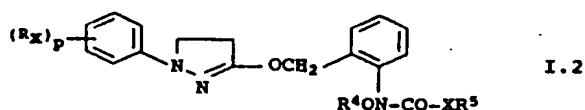


表 4

通式 I.2 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为乙基, 和 P_p^x 为表 A 中的一行所示取代基

表 5

通式 I.1 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氧基, 和 P_p^x 为表 A 中的一行所示取代基

表 6

通式 I.2 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氧基, R^2 为甲氧基, 和 P_p^x 为表 A 中的一行所示取代基

表 7

通式 I.1 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氨基, 和 P_p^x 为表 A 中的一行所示取代基

表 8

通式 I.2 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氨基, 和 P_p^x 为表 A 中的一行所示取代基

表 9

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲基, R^y 为氢, R^z 为氯, 和 P_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

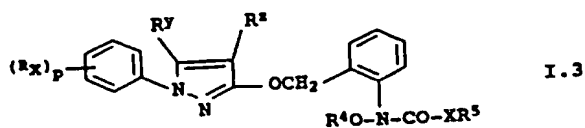


表 10

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为乙基, R^7 为氢, R^2 为氢, 和 R_p^8 为表 A 中的一行所列取代基

表 11

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氧基, R^7 为氢, R^2 为氢, 和 R_p^8 为表 A 中的一行所列取代基

表 12

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氨基, R^7 为氢, R^2 为氢, 和 R_p^8 为表 A 中的一行所列取代基

表 13

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲基, R^7 为甲基, R^2 为氢, 和 R_p^8 为表 A 中的一行所列取代基

表 14

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为乙基, R^7 为甲基, R^2 为氢, 和 R_p^8 为表 A 中的一行所列取代基

表 15

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氧基, R^7 为甲基, R^2 为氢, 和 R_p^8 为表 A 中的一行所列取代基

表 16

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氨基, R^7 为甲基, R^2 为氢, 和 R_p^8 为表 A 中的一行所列取代基

表 17

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲基, R^7 为三氟甲基, R^2 为氢, 和 R_p^8 为表 A 中的一行所列取代基

表 18

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为乙基, R^7 为三氟甲基, R^2 为氢, 和 R_p^8 为表 A 中的一行所列取代基

表 19

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氧基, R^7 为三氟

甲基, R^2 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 20

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为甲基, R^5X 为甲氨基, R^7 为三氟甲基, R^2 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 21

通式 I.4 的化合物, 式中, R^5X 为甲基, 和 R^1 、 R^7 、 R^2 、 R^3 和 R^4 的组合如表 B 中的一行所列

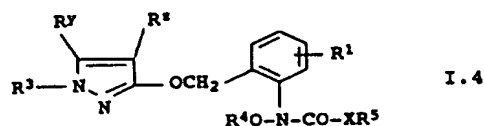


表 22

通式 I.4 的化合物, 式中, R^5X 为乙基, 和 R^1 、 R^7 、 R^2 、 R^3 和 R^4 的组合如表 B 中的一行所列

表 23

通式 I.4 的化合物, 式中, R^5X 为甲氧基, 和 R^1 、 R^7 、 R^2 、 R^3 和 R^4 的组合如表 B 中的一行所列

表 24

通式 I.4 的化合物, 式中, R^5X 为甲氨基, 和 R^1 、 R^7 、 R^2 、 R^3 和 R^4 的组合如表 B 中的一行所列

表 25

通式 I.1 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲基, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 26

通式 I.1 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为乙基, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 27

通式 I.2 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲基, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 28

通式 I.2 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为乙基, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 29

通式 I.1 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氧基, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 30

通式 I.2 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氧基, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 31

通式 I.1 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氨基, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 32

通式 I.2 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氨基, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 33

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲基, R^y 为氢, R^z 为氯, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 34

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为乙基, R^y 为氢, R^z 为氯, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 35

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氧基, R^y 为氢, R^z 为氯, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 36

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氨基, R^y 为氢, R^z 为氯, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 37

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲基, R^y 为甲基, R^z 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 38

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为乙基, R^7 为甲基, R^2 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 39

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氧基, R^7 为甲基, R^2 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 40

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氨基, R^7 为甲基, R^2 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 41

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲基, R^7 为三氟甲基, R^2 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 42

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为乙基, R^7 为三氟甲基, R^2 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 43

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氧基, R^7 为三氟甲基, R^2 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 44

通式 I.3 的化合物, 式中, R^4 为氢, R^5X 为甲氨基, R^7 为三氟甲基, R^2 为氢, 和 R_p^x 为表 A 中的一行所列取代基

表 A

编号	R^x_p
1	H
2	2-F
3	3-F
4	4-F
5	2,4-F ₂
6	2,4,6-F ₃
7	2,3,4,5,6-F ₅
8	2,3-F ₂
9	2-Cl
10	3-Cl
11	4-Cl
12	2,3-Cl ₂
13	2,4-Cl ₂
14	2,5-Cl ₂
15	2,6-Cl ₂
16	3,4-Cl ₂
17	3,5-Cl ₂
18	2,3,4-Cl ₃
19	2,3,5-Cl ₃
11	2,3,6-Cl ₃
12	2,4,5-Cl ₃
13	2,4,6-Cl ₃
14	3,4,5-Cl ₃
15	2,3,4,6-Cl ₄
16	2,3,5,6-Cl ₄
17	2,3,4,5,6-Cl ₅
18	2-Br

编号	R _p
19	3-Br
20	4-Br
21	2,4-Br ₂
22	2,5-Br ₂
23	2,6-Br ₂
24	2,4,6-Br ₃
25	2,3,4,5,6-Br ₅
26	2-I
27	3-I
28	4-I
29	2,4-I ₂
30	2-Cl, 3-F
31	2-Cl, 4-F
32	2-Cl, 5-F
33	2-Cl, 6-F
34	2-Cl, 3-Br
35	2-Cl, 4-Br
36	2-Cl, 5-Br
37	2-Cl, 6-Br
38	2-Br, 3-Cl
39	2-Br, 4-Cl
40	2-Br, 5-Cl
41	2-Br, 3-F
42	2-Br, 4-F
43	2-Br, 5-F
44	2-Br, 6-F
45	2-F, 3-Cl
46	2-F, 4-Cl
47	2-F, 5-Cl
48	3-Cl, 4-F
49	3-Cl, 5-F
50	3-Cl, 4-Br
51	3-Cl, 5-Br
52	3-F, 4-Cl
53	3-F, 4-Br
54	3-Br, 4-Cl
55	3-Br, 4-F
56	2,6-Cl ₂ , 4-Br
57	2-CH ₃

编号	R [*] _p
58	3-CH ₃
59	4-CH ₃
60	2,3-(CH ₃) ₂
61	2,4-(CH ₃) ₂
62	2,5-(CH ₃) ₂
63	2,6-(CH ₃) ₂
64	3,4-(CH ₃) ₂
65	3,5-(CH ₃) ₂
66	2,3,5-(CH ₃) ₃
67	2,3,4-(CH ₃) ₃
68	2,3,6-(CH ₃) ₃
69	2,4,5-(CH ₃) ₃
70	2,4,6-(CH ₃) ₃
71	3,4,5-(CH ₃) ₃
72	2,3,4,6-(CH ₃) ₄
73	2,3,5,6-(CH ₃) ₄
74	2,3,4,5,6-(CH ₃) ₅
75	2-C ₂ H ₅
76	3-C ₂ H ₅
77	4-C ₂ H ₅
78	2,4-(C ₂ H ₅) ₂
79	2,6-(C ₂ H ₅) ₂
80	3,5-(C ₂ H ₅) ₂
81	2,4,6-(C ₂ H ₅) ₃
82	2-n-C ₃ H ₇
83	3-n-C ₃ H ₇
84	4-n-C ₃ H ₇
85	2-i-C ₃ H ₇
86	3-i-C ₃ H ₇
87	4-i-C ₃ H ₇
88	2,4-(i-C ₃ H ₇) ₂
89	2,6-(i-C ₃ H ₇) ₂
90	3,5-(i-C ₃ H ₇) ₂
91	2-B-C ₄ H ₉
92	3-B-C ₄ H ₉
93	4-B-C ₄ H ₉
94	2-t-C ₄ H ₉
95	3-t-C ₄ H ₉
96	4-t-C ₄ H ₉

编号	R ^x _p
97	4-n-C ₉ H ₁₉
98	2-CH ₃ , 4-t-C ₄ H ₉
99	2-CH ₃ , 6-t-C ₄ H ₉
100	2-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇
101	2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇
102	3-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇
103	2-环 -C ₆ H ₁₁
104	3-环 -C ₆ H ₁₁
105	4-环 -C ₆ H ₁₁
106	2-Cl, 4-C ₆ H ₅
107	2-Br, 4-C ₆ H ₅
108	2-OCH ₃
109	3-OCH ₃
110	4-OCH ₃
111	2-OC ₂ H ₅
112	3-O-C ₂ H ₅
113	4-O-C ₂ H ₅
114	2-O-n-C ₃ H ₇
115	3-O-n-C ₃ H ₇
116	4-O-n-C ₃ H ₇
117	2-O-i-C ₃ H ₇
118	3-O-i-C ₃ H ₇
119	4-O-i-C ₃ H ₇
120	2-O-n-C ₆ H ₁₃
121	3-O-n-C ₆ H ₁₃
122	4-O-n-C ₆ H ₁₃
123	2-O-CH ₂ C ₆ H ₅
124	3-O-CH ₂ C ₆ H ₅
125	4-O-CH ₂ C ₆ H ₅
126	2-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅
127	4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅
128	2,3-(OCH ₃) ₂
129	2,4-(OCH ₃) ₂
130	2,5-(OCH ₃) ₂
131	2,6-(OCH ₃) ₂
132	3,4-(OCH ₃) ₂
133	3,5-(OCH ₃) ₂
134	2-O-t-C ₄ H ₉
135	3-O-t-C ₄ H ₉

编号	R [*] _p
136	4-O-t-C ₆ H ₉
137	3-(3'-Cl-C ₆ H ₄)
138	4-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄)
139	2-O-C ₆ H ₅
140	3-O-C ₆ H ₅
141	4-O-C ₆ H ₅
142	2-O-(2'-F-C ₆ H ₄)
143	3-O-(3'-Cl-C ₆ H ₄)
144	4-O-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄)
145	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-F
146	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Cl
147	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Br
148	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-F
149	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Cl
150	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Br
151	2-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl, 5-CH ₃
152	2-Cl, 4-NO ₂
153	2-NO ₂ , 4-Cl
154	2-OCH ₃ , 5-NO ₂
155	2,4-Cl ₂ , 5-NO ₂
156	2,4-Cl ₂ , 6-NO ₂
157	2,6-Cl ₂ , 4-NO ₂
158	2,6-Br ₂ , 4-NO ₂
159	2,6-I ₂ , 4-NO ₂
160	2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl
161	2-CO ₂ CH ₃
162	3-CO ₂ CH ₃
163	4-CO ₂ CH ₃
164	2-CH ₂ -OCH ₃
165	3-CH ₂ -OCH ₃
166	4-CH ₂ -OCH ₃
167	2-Me-4-CH ₃ -CH(CH ₃)-CO
168	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃)
169	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₂ CH ₃)
170	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇)
171	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-i-C ₃ H ₇)
172	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃)
173	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₂ CH ₃)
174	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇)

编号	R ^x _p
175	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NO-1-C ₃ H ₇)
176	2-C ₆ H ₅
177	3-C ₆ H ₅
178	4-C ₆ H ₅
179	2-(2'-F-C ₆ H ₄)
180	2-CH ₃ , 5-Br
181	2-CH ₃ , 6-Br
182	2-Cl, 3-CH ₃
183	2-Cl, 4-CH ₃
184	2-Cl, 5-CH ₃
185	2-F, 3-CH ₃
186	2-F, 4-CH ₃
187	2-F, 5-CH ₃
188	2-Br, 3-CH ₃
189	2-Br, 4-CH ₃
190	2-Br, 5-CH ₃
191	3-CH ₃ , 4-Cl
192	3-CH ₃ , 5-Cl
193	3-CH ₃ , 4-F
194	3-CH ₃ , 5-F
195	3-CH ₃ , 4-Br
196	3-CH ₃ , 5-Br
197	3-F, 4-CH ₃
198	3-Cl, 4-CH ₃
199	3-Br, 4-CH ₃
200	2-Cl, 4,5-(CH ₃) ₂
201	2-Br, 4,5-(CH ₃) ₂
202	2-Cl, 3,5-(CH ₃) ₂
203	2-Br, 3,5-(CH ₃) ₂
204	2,6-Cl ₂ , 4-CH ₃
205	2,6-F ₂ , 4-CH ₃
206	2,6-Br ₂ , 4-CH ₃
207	2,4-Br ₂ , 6-CH ₃
208	2,4-F ₂ , 6-CH ₃
209	2,4-Br ₂ , 6-CH ₃
210	2,6-(CH ₃) ₂ , 4-F
211	2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Cl
212	2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Br
213	3,5-(CH ₃) ₂ , 4-F

编号	R ^x _p
214	3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Cl
215	3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Br
216	2-CF ₃
217	3-CF ₃
218	4-CF ₃
219	2-OCF ₃
220	3-OCF ₃
221	4-OCF ₃
222	3-OCH ₂ CHF ₂
223	2-NO ₂
224	3-NO ₂
225	4-NO ₂
226	2-CN
227	3-CN
228	4-CN
229	2-CH ₃ , 3-Cl
230	2-CH ₃ , 4-Cl
231	2-CH ₃ , 5-Cl
232	2-CH ₃ , 6-Cl
233	2-CH ₃ , 3-F
234	2-CH ₃ , 4-F
235	2-CH ₃ , 5-F
236	2-CH ₃ , 6-F
237	2-CH ₃ , 3-Br
238	2-CH ₃ , 4-Br
239	2-吡啶基 -2'
240	3- 吡啶基 -3'
241	4- 吡啶基 -4'

表 B

编号	R ¹	R ^Y	R ²	R ³	R ⁴
1	H	H	H	环己基	CH ₃
2	H	H	H	苄基	CH ₃
3	H	H	H	2-吡啶基	CH ₃
4	H	H	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₃
5	H	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₃
6	H	H	H	2-吡啶基	CH ₃
7	H	H	Cl	环己基	CH ₃
8	H	H	Cl	苄基	CH ₃

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	
9	H	H	Cl	2-吡啶基	CH ₃
10	H	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₃
11	H	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₃
12	H	H	Cl	2-吡嗪基	CH ₃
13	H	CH ₃	H	环己基	CH ₃
14	H	CH ₃	H	苄基	CH ₃
15	H	CH ₃	H	2-吡啶基	CH ₃
16	H	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₃
17	H	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₃
18	H	CH ₃	H	2-吡嗪基	CH ₃
19	H	H	H	环己基	C ₂ H ₅
20	H	H	H	苄基	C ₂ H ₅
21	H	H	H	苯基	C ₂ H ₅
22	H	H	H	2-吡啶基	C ₂ H ₅
23	H	H	H	5-Cl-吡啶基 -2	C ₂ H ₅
24	H	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	C ₂ H ₅
25	H	H	H	2-吡嗪基	C ₂ H ₅
26	H	H	Cl	环己基	C ₂ H ₅
27	H	H	Cl	苄基	C ₂ H ₅
28	H	H	Cl	苯基	C ₂ H ₅
29	H	H	Cl	2-吡啶基	C ₂ H ₅
30	H	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2	C ₂ H ₅
31	H	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2	C ₂ H ₅
32	H	H	Cl	2-吡嗪基	C ₂ H ₅
33	H	CH ₃	H	环己基	C ₂ H ₅
34	H	CH ₃	H	苄基	C ₂ H ₅
35	H	CH ₃	H	苯基	C ₂ H ₅
36	H	CH ₃	H	2-吡啶基	C ₂ H ₅
37	H	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	C ₂ H ₅
38	H	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	C ₂ H ₅
39	H	CH ₃	H	2-吡嗪基	C ₂ H ₅
40	H	H	H	环己基	CH ₂ OCH ₃
41	H	H	H	苄基	CH ₂ OCH ₃
42	H	H	H	苯基	CH ₂ OCH ₃
43	H	H	H	2-吡啶基	CH ₂ OCH ₃
44	H	H	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
45	H	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
46	H	H	H	2-吡嗪基	CH ₂ OCH ₃
47	H	H	Cl	环己基	CH ₂ OCH ₃

编号、	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	
48	H	H	Cl	苄基	CH ₂ OCH ₃
49	H	H	Cl	苯基	CH ₂ OCH ₃
50	H	H	Cl	2-吡啶基	CH ₂ OCH ₃
51	H	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
52	H	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
53	H	H	Cl	2-噻吩基	CH ₂ OCH ₃
54	H	CH ₃	H	环己基	CH ₂ OCH ₃
55	H	CH ₃	H	苄基	CH ₂ OCH ₃
56	H	CH ₃	H	苯基	CH ₂ OCH ₃
57	H	CH ₃	H	2-吡啶基	CH ₂ OCH ₃
58	H	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
59	H	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
60	H	CH ₃	H	2-噻吩基	CH ₂ OCH ₃
61	H	H	H	环己基	CH ₂ C≡CH
62	H	H	H	苄基	CH ₂ C≡CH
63	H	H	H	苯基	CH ₂ C≡CH
64	H	H	H	2-吡啶基	CH ₂ C≡CH
65	H	H	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
66	H	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
67	H	H	H	2-噻吩基	CH ₂ C≡CH
68	H	H	Cl	环己基	CH ₂ C≡CH
69	H	H	Cl	苄基	CH ₂ C≡CH
70	H	H	Cl	苯基	CH ₂ C≡CH
71	H	H	Cl	2-吡啶基	CH ₂ C≡CH
72	H	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
73	H	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
74	H	H	Cl	2-噻吩基	CH ₂ C≡CH
75	H	CH ₃	H	环己基	CH ₂ C≡CH
76	H	CH ₃	H	苄基	CH ₂ C≡CH
77	H	CH ₃	H	苯基	CH ₂ C≡CH
78	H	CH ₃	H	2-吡啶基	CH ₂ C≡CH
79	H	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
80	H	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
81	H	CH ₃	H	2-噻吩基	CH ₂ C≡CH
82	3-F	H	H	环己基	CH ₃
83	3-F	H	H	苄基	CH ₃
84	3-F	H	H	苯基	CH ₃
85	3-F	H	H	2-吡啶基	CH ₃
86	3-F	H	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₃

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
87	3-F	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
88	3-F	H	H	2-吡啶基
89	3-F	H	Cl	环己基
90	3-F	H	Cl	苄基
91	3-F	H	Cl	苯基
92	3-F	H	Cl	2-吡啶基
93	3-F	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2
94	3-F	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2
95	3-F	H	Cl	2-吡啶基
96	3-F	CH ₃	H	环己基
97	3-F	CH ₃	H	苄基
98	3-F	CH ₃	H	苯基
99	3-F	CH ₃	H	2-吡啶基
100	3-F	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2
101	3-F	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
102	3-F	CH ₃	H	2-吡啶基
103	3-F	H	H	环己基
104	3-F	H	H	苄基
105	3-F	H	H	苯基
106	3-F	H	H	2-吡啶基
107	3-F	H	H	5-Cl-吡啶基 -2
108	3-F	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
109	3-F	H	H	2-吡啶基
110	3-F	H	Cl	环己基
111	3-F	H	Cl	苄基
112	3-F	H	Cl	苯基
113	3-F	H	Cl	2-吡啶基
114	3-F	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2
115	3-F	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2
116	3-F	H	Cl	2-吡啶基
117	3-F	H	H	环己基
118	3-F	H	H	苄基
119	3-F	H	H	苯基
120	3-F	H	H	2-吡啶基
121	3-F	H	H	5-Cl-吡啶基 -2
122	3-F	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
123	3-F	H	H	2-吡啶基
124	3-F	H	Cl	环己基
125	3-F	H	Cl	苄基

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
126	3-F	H	Cl	苯基 CH ₂ OCH ₃
127	3-F	H	Cl	2-吡啶基 CH ₂ OCH ₃
128	3-F	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2 CH ₂ OCH ₃
129	3-F	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2 CH ₂ OCH ₃
130	3-F	H	Cl	2-吡嗪基 CH ₂ OCH ₃
131	3-F	CH ₃	H	环己基 CH ₂ OCH ₃
132	3-F	CH ₃	H	苄基 CH ₂ OCH ₃
133	3-F	CH ₃	H	苯基 CH ₂ OCH ₃
134	3-F	CH ₃	H	2-吡啶基 CH ₂ OCH ₃
135	3-F	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2 CH ₂ OCH ₃
136	3-F	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2 CH ₂ OCH ₃
137	3-F	CH ₃	H	2-吡嗪基 CH ₂ OCH ₃
138	3-F	H	H	环己基 CH ₂ C≡CH
139	3-F	H	H	苄基 CH ₂ C≡CH
140	3-F	H	H	苯基 CH ₂ C≡CH
141	3-F	H	H	2-吡啶基 CH ₂ C≡CH
142	3-F	H	H	5-Cl-吡啶基 -2 CH ₂ C≡CH
143	3-F	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2 CH ₂ C≡CH
144	3-F	H	H	2-吡嗪基 CH ₂ C≡CH
145	3-F	H	Cl	环己基 CH ₂ C≡CH
146	3-F	H	Cl	苄基 CH ₂ C≡CH
147	3-F	H	Cl	苯基 CH ₂ C≡CH
148	3-F	H	Cl	2-吡啶基 CH ₂ C≡CH
149	3-F	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2 CH ₂ C≡CH
150	3-F	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2 CH ₂ C≡CH
151	3-F	H	Cl	2-吡嗪基 CH ₂ C≡CH
152	3-F	CH ₃	H	环己基 CH ₂ C≡CH
153	3-F	CH ₃	H	苄基 CH ₂ C≡CH
154	3-F	CH ₃	H	苯基 CH ₂ C≡CH
155	3-F	CH ₃	H	2-吡啶基 CH ₂ C≡CH
156	3-F	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2 CH ₂ C≡CH
157	3-F	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2 CH ₂ C≡CH
158	3-F	CH ₃	H	2-吡嗪基 CH ₂ C≡CH
159	6-Cl	H	H	环己基 CH ₃
160	6-Cl	H	H	苄基 CH ₃
161	6-Cl	H	H	苯基 CH ₃
162	6-Cl	H	H	2-吡啶基 CH ₃
163	6-Cl	H	H	5-Cl-吡啶基 -2 CH ₃
164	6-Cl	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2 CH ₃

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	
165	6-Cl	H	H	2-吡啶基	CH ₃
166	6-Cl	H	Cl	环己基	CH ₃
167	6-Cl	H	Cl	苄基	CH ₃
168	6-Cl	H	Cl	苯基	CH ₃
169	6-Cl	H	Cl	2-吡啶基	CH ₃
170	6-Cl	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₃
171	6-Cl	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₃
172	6-Cl	H	Cl	2-吡啶基	CH ₃
173	6-Cl	CH ₃	H	环己基	CH ₃
174	6-Cl	CH ₃	H	苄基	CH ₃
175	6-Cl	CH ₃	H	苯基	CH ₃
176	6-Cl	CH ₃	H	2-吡啶基	CH ₃
177	6-Cl	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₃
178	6-Cl	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₃
179	6-Cl	CH ₃	H	2-吡啶基	CH ₃
180	6-Cl	H	H	环己基	C ₂ H ₅
181	6-Cl	H	H	苄基	C ₂ H ₅
182	6-Cl	H	H	苯基	C ₂ H ₅
183	6-Cl	H	H	2-吡啶基	C ₂ H ₅
184	6-Cl	H	H	5-Cl-吡啶基 -2	C ₂ H ₅
185	6-Cl	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	C ₂ H ₅
186	6-Cl	H	H	2-吡啶基	C ₂ H ₅
187	6-Cl	H	Cl	环己基	C ₂ H ₅
188	6-Cl	H	Cl	苄基	C ₂ H ₅
189	6-Cl	H	Cl	苯基	C ₂ H ₅
190	6-Cl	H	Cl	2-吡啶基	C ₂ H ₅
191	6-Cl	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2	C ₂ H ₅
192	6-Cl	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2	C ₂ H ₅
193	6-Cl	H	Cl	2-吡啶基	C ₂ H ₅
194	6-Cl	CH ₃	H	环己基	C ₂ H ₅
195	6-Cl	CH ₃	H	苄基	C ₂ H ₅
196	6-Cl	CH ₃	H	苯基	C ₂ H ₅
197	6-Cl	CH ₃	H	2-吡啶基	C ₂ H ₅
198	6-Cl	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	C ₂ H ₅
199	6-Cl	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	C ₂ H ₅
200	6-Cl	CH ₃	H	2-吡啶基	C ₂ H ₅
201	6-Cl	H	H	环己基	CH ₂ OCH ₃
202	6-Cl	H	H	苄基	CH ₂ OCH ₃
203	6-Cl	H	H	苯基	CH ₂ OCH ₃

编号:	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
204	6-Cl	H	H	2-吡啶基
205	6-Cl	H	H	5-Cl-吡啶基 -2
206	6-Cl	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
207	6-Cl	H	H	2-噻唑基
208	6-Cl	H	Cl	环己基
209	6-Cl	H	Cl	苄基
210	6-Cl	H	Cl	苯基
211	6-Cl	H	Cl	2-吡啶基
212	6-Cl	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2
213	6-Cl	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2
214	6-Cl	H	Cl	2-噻唑基
215	6-Cl	CH ₃	H	环己基
216	6-Cl	CH ₃	H	苄基
217	6-Cl	CH ₃	H	苯基
218	6-Cl	CH ₃	H	2-吡啶基
219	6-Cl	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2
220	6-Cl	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
221	6-Cl	CH ₃	H	2-噻唑基
222	6-Cl	H	H	环己基
223	6-Cl	H	H	苄基
224	6-Cl	H	H	苯基
225	6-Cl	H	H	2-吡啶基
226	6-Cl	H	H	5-Cl-吡啶基 -2
227	6-Cl	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
228	6-Cl	H	H	2-噻唑基
229	6-Cl	H	Cl	环己基
230	6-Cl	H	Cl	苄基
231	6-Cl	H	Cl	苯基
232	6-Cl	H	Cl	2-吡啶基
233	6-Cl	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2
234	6-Cl	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2
235	6-Cl	H	Cl	2-噻唑基
236	6-Cl	CH ₃	H	环己基
237	6-Cl	CH ₃	H	苄基
238	6-Cl	CH ₃	H	苯基
239	6-Cl	CH ₃	H	2-吡啶基
240	6-Cl	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2
241	6-Cl	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
242	6-Cl	CH ₃	H	2-噻唑基

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
243	6-CH ₃	H	H	环己基
244	6-CH ₃	H	H	苄基
245	6-CH ₃	H	H	苯基
246	6-CH ₃	H	H	2-吡啶基
247	6-CH ₃	H	H	5-Cl-吡啶基 -2
248	6-CH ₃	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
249	6-CH ₃	H	H	2-吡嗪基
250	6-CH ₃	H	Cl	环己基
251	6-CH ₃	H	Cl	苄基
252	6-CH ₃	H	Cl	苯基
253	6-CH ₃	H	Cl	2-吡啶基
254	6-CH ₃	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2
255	6-CH ₃	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2
256	6-CH ₃	H	Cl	2-吡嗪基
257	6-CH ₃	CH ₃	H	环己基
258	6-CH ₃	CH ₃	H	苄基
259	6-CH ₃	CH ₃	H	苯基
260	6-CH ₃	CH ₃	H	2-吡啶基
261	6-CH ₃	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2
262	6-CH ₃	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
263	6-CH ₃	CH ₃	H	2-吡嗪基
264	6-CH ₃	H	H	环己基
265	6-CH ₃	H	H	苄基
266	6-CH ₃	H	H	苯基
267	6-CH ₃	H	H	2-吡啶基
268	6-CH ₃	H	H	5-Cl-吡啶基 -2
269	6-CH ₃	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2
270	6-CH ₃	H	H	2-吡嗪基
271	6-CH ₃	H	Cl	环己基
272	6-CH ₃	H	Cl	苄基
273	6-CH ₃	H	Cl	苯基
274	6-CH ₃	H	Cl	2-吡啶基
275	6-CH ₃	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2
276	6-CH ₃	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2
277	6-CH ₃	H	Cl	2-吡嗪基
278	6-CH ₃	CH ₃	H	环己基
279	6-CH ₃	CH ₃	H	苄基
280	6-CH ₃	CH ₃	H	苯基
281	6-CH ₃	CH ₃	H	2-吡啶基

编号:	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	
282	6-CH ₃	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	C ₂ H ₅
283	6-CH ₃	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	C ₂ H ₅
284	6-CH ₃	CH ₃	H	2-吡啶基	C ₂ H ₅
285	6-CH ₃	H	H	环己基	CH ₂ OCH ₃
286	6-CH ₃	H	H	苄基	CH ₂ OCH ₃
287	6-CH ₃	H	H	苯基	CH ₂ OCH ₃
288	6-CH ₃	H	H	2-吡啶基	CH ₂ OCH ₃
289	6-CH ₃	H	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
290	6-CH ₃	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
291	6-CH ₃	H	H	2-吡啶基	CH ₂ OCH ₃
292	6-CH ₃	H	Cl	环己基	CH ₂ OCH ₃
293	6-CH ₃	H	Cl	苄基	CH ₂ OCH ₃
294	6-CH ₃	H	Cl	苯基	CH ₂ OCH ₃
295	6-CH ₃	H	Cl	2-吡啶基	CH ₂ OCH ₃
296	6-CH ₃	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
297	6-CH ₃	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
298	6-CH ₃	H	Cl	2-吡啶基	CH ₂ OCH ₃
299	6-CH ₃	CH ₃	H	环己基	CH ₂ OCH ₃
300	6-CH ₃	CH ₃	H	苄基	CH ₂ OCH ₃
301	6-CH ₃	CH ₃	H	苯基	CH ₂ OCH ₃
302	6-CH ₃	CH ₃	H	2-吡啶基	CH ₂ OCH ₃
303	6-CH ₃	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
304	6-CH ₃	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ OCH ₃
305	6-CH ₃	CH ₃	H	2-吡啶基	CH ₂ OCH ₃
306	6-CH ₃	H	H	环己基	CH ₂ C≡CH
307	6-CH ₃	H	H	苄基	CH ₂ C≡CH
308	6-CH ₃	H	H	苯基	CH ₂ C≡CH
309	6-CH ₃	H	H	2-吡啶基	CH ₂ C≡CH
310	6-CH ₃	H	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
311	6-CH ₃	H	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
312	6-CH ₃	H	H	2-吡啶基	CH ₂ C≡CH
313	6-CH ₃	H	Cl	环己基	CH ₂ C≡CH
314	6-CH ₃	H	Cl	苄基	CH ₂ C≡CH
315	6-CH ₃	H	Cl	苯基	CH ₂ C≡CH
316	6-CH ₃	H	Cl	2-吡啶基	CH ₂ C≡CH
317	6-CH ₃	H	Cl	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
318	6-CH ₃	H	Cl	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
319	6-CH ₃	H	Cl	2-吡啶基	CH ₂ C≡CH
320	6-CH ₃	CH ₃	H	环己基	CH ₂ C≡CH

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	
321	6-CH ₃	CH ₃	H	苄基	CH ₂ C≡CH
322	6-CH ₃	CH ₃	H	苄基	CH ₂ C≡CH
323	6-CH ₃	CH ₃	H	2-吡啶基	CH ₂ C≡CH
324	6-CH ₃	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
325	6-CH ₃	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	CH ₂ C≡CH
326	6-CH ₃	CH ₃	H	2-吡嗪基	CH ₂ C≡CH
327	3-F	CH ₃	H	环己基	C ₂ H ₅
328	3-F	CH ₃	H	苄基	C ₂ H ₅
329	3-F	CH ₃	H	苄基	C ₂ H ₅
330	3-F	CH ₃	H	2-吡啶基	C ₂ H ₅
331	3-F	CH ₃	H	5-Cl-吡啶基 -2	C ₂ H ₅
332	3-F	CH ₃	H	5-CF ₃ -吡啶基 -2	C ₂ H ₅
333	3-F	CH ₃	H	2-吡嗪基	C ₂ H ₅

本发明式 I 所示化合物适宜于防治有害真菌和昆虫、蛛形纲和线虫类的动物害虫。它们可作为杀真菌剂和杀虫剂用于作物保护、卫生学、储藏物质保护和兽医等方面。

有害昆虫包括：

来自蝶(鳞翅目)，例如茶小卷叶蛾(*Adoxophyes orana*)、小地老虎(*Agrotis ypsilon*)、黄地老虎(*Agrotis segetum*)、棉叶波纹夜蛾(*Alabama argillacea*)、黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatallis*)、苹实巢蛾(*Argyresthia conjugella*)、汉马夜蛾(*Autographa gamma*)、卷叶蛾(*Cacoe-cia murinana*)、卷蛾(*Capua reticulana*)、枫色卷蛾(*Choristoneura fumiferana*)、玉米螟(*Chilo partellus*)、西方云杉卷叶蛾(*Choristoneura Occidentalis*)、美洲粘虫(*Cirphis Unipuncta*)、稻纵卷叶螟(*Cnaphalocrocis medinalis*)、(Crocitolomia binotalis)、苹蠹蛾(*Cydia pomonella*)、欧洲松毛虫(*Dendrolimns pini*)、瓜野螟(*Diaphania nitalis*)、巨座玉米螟(*Diatraea grandiosella*)、棉斑实蛾(*Earias insulana*)、小玉米螟(*Elasmopalpus lignosellus*)、(Eupoecilia ambiguella)、

粒肤地老虎(*Feltia Subterranea*)、李小食心虫(*Grapholitha funebrana*)、梨小食心虫(*Grapholitha molesta*)、棉铃虫(*Heliothis armigera*)、烟芽夜蛾(*Heliothis Virescens*)、棉铃虫(*Heliothis zea*)、菜螟(*Helula Undalis*)、(Hibernia defoliaria)、美国白蛾(*Hyphantria cunea*)、苹果巢蛾(*Hyponomeuta malinellus*)、蕃茄蠹蛾(*Keiferia lycopersicella*)、铁杉尺蠖(*Lambdina fiscellaria*)、甜菜夜蛾(*Laphygma exigua*)、旋纹潜蛾(*Leucoptera scitella*)、细蛾(*Lithocolletis blancardella*)、小卷蛾(*Lobesia botrana*)、黄绿条螟(*Loxostege sticticalis*)、舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、僧尾毒蛾(*Lymantria monacha*)、桃潜蛾(*Lyonetia clerkella*)、烟草天蛾(*Manduca sexta*)、天幕毛虫(*Malacosoma neustria*)、甘蓝夜蛾(*Mamestra brassicae*)、稻毛胫夜蛾(*Mocis repanda*)、冬尺蛾(*Operophtera brumata*)、花旗松毒蛾(*Orgyia pseudotsugata*)、玉米螟(*Ostrinia nubilalis*)、林黄卷叶蛾(*Pandemis heparana*)、小眼夜蛾(*Panolis flammea*)、棉红铃虫(*Pectinophora gossypiella*)、马铃薯麦蛾(*Phthorimaea operculella*)、桔叶潜蛾(*Phyllocnistis citrella*)、大菜粉蝶(*Pieris brassicae*)、苜蓿绿夜蛾(*Plathypena scabra*)、荷兰石竹小卷蛾(*Platynota stultana*)、小菜蛾(*Plutella xylostella*)、桔花巢蛾(*Prays citri*)、油橄榄巢蛾(*Prays Oleae*)、斜纹夜蛾(*Prodenia sunia*)、斜纹夜蛾(*Prodenia ornithogalli*)、大豆夜蛾(*Pseudoplusia includens*)、二三针松小卷蛾(*Rhyacionia frustrana*)、(Scrobipalpula absoluta)、大螟(*Sesamia inferens*)、葡萄长须卷蛾(*Sparganothis pilleriana*)、草地贪夜蛾(*Spodoptera frugiperda*)、斜纹夜蛾(*Spodoptera littoralis*)、斜纹夜蛾(*Spodoptera litura*)、(Syllepta elerogata)、红带透翅蛾(*Synanthedon myopaeformis*)、(Thaumatopoea pityocampa)、栎绿卷叶蛾(*Tortrix viridana*)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni*)、三化螟(*Tryporyza incertulaos*)、云杉小卷叶蛾(*Zeiraphera canadensis*)、再有蜡螟(*Galleria mellonella*)和麦蛾(*Sitotroga cerealella*)、粉斑螟(*Ephestia cautella*)、幕夜蛾(*Tineola bisselliella*)；

来自甲虫(鞘翅目),例如具条叩甲(*Agriotes lineatus*)、晦暗叩甲(*Agriotes Obscurus*)、棉铃象甲(*Anthonomus grandis*)、苹果花象甲

(*Anthonomus pomorum*)、象甲(*Apion vorax*)、甜菜隐食甲(*Atomaria linearis*)、大松小蠹(*Blastophagus piniperda*)、甜菜大龟甲(*Cassida nebulosa*)、豆叶甲(*Cerotoma trifurcata*)、甘蓝菜象甲(*Ceuthorhynchus assimilis*)、象甲(*Ceuthorhynchus napi*)、甜菜茎跳甲(*Chaetocnema tibialis*)、烟草金针虫(*Conoderus vespertinus*)、天冬门叶甲(*Crioceris asparagi*)、小蠹(*Dendroctonus refipennis*)、长角叶甲(*Diabrotica Longicornis*)、十二斑叶甲(*Diabrotica 12 - punctata*)、玉米幼芽根叶虫甲(*Diabrotica Virgifera*)、墨西哥豆瓢虫(*Epilachna varivestis*)、烟草跳甲(*Epitrix hirtipennis*)、棉籽灰象甲(*Eutinobothrus brasiliensis*)、松树皮象(*Hylobius abietis*)、埃及苜蓿象甲(*Hypera brunneipennis*)、苜蓿叶象甲(*Hypera postica*)、云杉八齿小蠹(*Zps typographus*)、烟负泥虫(*Lema bilineata*)、橙足负泥虫(*Lema melanopus*)、马铃薯甲虫(*Leptinotarsa decemlineata*)、甜菜金针虫(*Limonius californicus*)、美洲稻象甲(*lissorhoptrus oryzophilus*)、玉米叩甲(*Melanotus Communis*)、油菜花露尾甲(*Meligethes aeneus*)、(*Melolontha hippocastani*)、(*Melolontha melolontha*)、稻负泥虫(*Oulema oryzae*)、(*Ortiorrhynchus sulcatus*)、草莓耳喙象(*Otiorrhynchus ovatus*)、辣根猿叶虫(*Phaedon cochleariae*)、庭园丽金龟(*phyllopertha horticola*)、鳃角金龟(*phyllophaga SP.*)、条跳甲(*phyllostreta chrysocephala*)、芜菁淡足跳甲(*phyllostreta nemorum*)、曲条跳甲(*phyllostreta striolata*)、日本丽金龟(*Popillia japonica*)、跳甲(*Psylliodes napi*)、栎黑小蠹(*Scolytus intricatus*)、根瘤象甲(*Sitona lineatus*)、再有蚕豆象(*Bruchus rufimanus*)、豌豆象(*Bruchus pisorum*)、豆象(*Bruchus Lentis*)、谷象(*Sitophilus granaria*)、草窃蠹(*Lasioderma serricorne*)、锯谷盗(*Oryzaephilus surinamensis*)、谷蠹(*Rhyzopertha dominica*)、米象(*Sitophilus oryzae*)、赤拟谷盗(*Tribolium castaneum*)、谷斑及蠹(*Trogoderma granarium*)、墨西哥豆象(*Zabrotes subfasciatus*);

来自双翅目的昆虫(双翅目),例如,墨西哥桔实蝇(*Anastrepha ludens*)、地中海实蝇(*Ceratitis capitata*)、高粱瘿蚊(*Contarinia*

sorghicola)、瓜实蝇(*Dacus cucurbitae*)、油橄榄实蝇(*Dacus oleae*)、芸苔荚瘿蚊(*Dasineura brassicae*)、(*Delia coarctata*)、(*Delia radium*)、大麦水蝇(*Hydrellia griseola*)、种蝇(*Hylemyia platura*)、潜蝇(*Liriomyza sativae*)、潜蝇(*Liriomyza trifolii*)、小麦瘿蚊(*Mayetiola destructor*)、(*Orseolia oryzae*)、瑞典麦秆蝇(*Oscinella frit*)、菠菜潜叶花蝇(*Pegomya hyoscyami*)、(*Phorbia antiqua*)、(*Phorbia brassicae*)、(*Phorbia Loarctata*)、樱桃实蝇(*Rhagoletis cerasi*)、苹果实蝇(*Rhagoletis pomonella*)、大蚊(*Tipula Oleracea*)、沼泽大蚊(*Tipula paludosa*)、还有埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、骚扰伊蚊(*Aedes vexans*)、五斑按蚊(*Anopheles maculipennis*)、倍氏金蝇(*Chrysomya bezziana*)、金蝇(*Chrysomya hominivorax*)、腐败金蝇(*Chrysomya macellaria*)、嗜人腐蝇(*Cordylobia anthropophaga*)、尖音库蚊(*Culex pipiens*)、黄腹厩蝇(*Fannia canicularis*)、大马胃蝇(*Gasterophilus intestinalis*)、舌蝇(*Glossina morsitans*)、扰血蝇(*Haematobia irritans*)、(*Haplodiplosis equestris*)、纹皮蝇(*Hypoderma lineata*)、绿蝇(*Lucilia caprina*)、绿蝇(*Lucilia cuprina*)、丝光绿蝇(*Lucilia sericata*)、家蝇(*Musca domestica*)、厩腐蝇(*Muscina stabulans*)、羊鼻蝇(*Oestrus ovis*)、虻(*Tabanus bovinus*)、蚋(*Simulium damnosum*)；

来自蓟马(缨翅目)，例如，烟草褐蓟马(*Frankliniella fusca*)、苜蓿蓟马(*Frankliniella Occidentalis*)、花蓟马(*Frankliniella tritici*)、小麦管蓟马(*Haplothrips tritici*)、桔实蓟马(*Scirtothrips citri*)、稻蓟马(*Thrips oryzae*)、棕黄蓟马(*Thrips palmi*)、棉蓟马(*Thrips tabaci*)；

来自膜翅目的昆虫(膜翅目)，例如，菜叶蜂(*Athalia rosae*)、热带切叶蚁(*Atta cephalotes*)、切叶蚁(*Atta sexdens*)、切叶蚁(*Atta texana*)、叶蜂(*Hoplocampa minuta*)、苹实叶蜂(*Hoplocampa testudinea*)、阿根廷蚁(*Iridomyrmex humilis*)、虹蚁(*Iridomyrmex purpureus*)、法老蚁(*Monomorium pharaonis*)、火蚁(*Solenopsis geminata*)、红外来火蚁(*Solenopsis invicta*)、黑外来火蚁(*Solenopsis richteri*)；

来自臭虫(异翅亚目)，例如，喜绿椿(*Acrosternum hilare*)、玉米长椿(*Blissus leucopterus*)、烟草黑斑盲椿(*Lyrtopeltis notatus*)、棉红

蝽(*Dysdercus cingulatus*)、红蝽(*Dysdercus intermedius*)、盾蝽(*Eurygaster integriceps*)、棉褐蝽(*Euschistus impictiventris*)、叶足缘蝽(*Leptoglossus phyllopus*)、豆英盲蝽(*Lygus hesperus*)、牧草盲蝽(*Lygus lineolaris*)、牧草盲蝽(*Lygus pratensis*)、稻绿蝽(*Nezara viridula*)、甜菜拟网蝽(*Piesma quadrata*)、(*Solubea insularis*)、(*Thyanta perditor*)；

来自吮吸植物的昆虫(同翅目)，例如，无网长管蚜(*Acyrtosiphon onobrychis*)、豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum*)、落叶松球蚜(*Adelges laricis*)、红圆蚧(*Aonidiella aurantii*)、蚜茧蜂(*Aphidula nasturtii*)、甜菜蚜(*Aphis fabae*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、苹果蚜(*Aphis pomi*)、茄沟无网蚜(*Aulacorthum solani*)、甘薯粉虱(*Bemisia tabaci*)、蓟短尾蚜(*Brachycaudus cardui*)、甘蓝蚜(*Brevicoryne brassicae*)、(*Dalbulus maidis*)、(*Dreyfusia nordmannianae*)、(*Dreyfusia piceae*)、圆尾蚜(*Dysaphis radicola*)、蚕豆微叶蜂(*Empoasca fabae*)、苹果绵蚜(*Eriosoma lanigerum*)、稻灰飞虱(*Laodelphax striatella*)、麦长管蚜(*Macrosiphum avenae*)、马铃薯长管蚜(*Macrosiphum euphorbiae*)、(*Macrosiphon rosae*)、(*Megoura viciae*)、薔薇麦蚜(*Metopolophium dirhodum*)、桃赤蚜(*Myzus persicae*)、樱桃黑瘤蚜(*Myzus cerasi*)、黑尾叶蝉(*Nephotettix cincticeps*)、稻褐飞虱(*Nilaparvata lugens*)、蔗飞虱(*Perkinsiella saccharicida*)、忽布疣蚜(*Phorodon humuli*)、桔粉蚧(*Planococcus citri*)、苹木虱(*Psylla mali*)、梨木虱(*Psylla pyri*)、梨黄木虱(*Psylla pyricol*)、梨笠圆盾蚧(*Quadraspidiotus perniciosus*)、玉米蚜(*Rhopalosiphum maidis*)、蝥蚧(*Saissetia oleae*)、草间裂蚜茧蜂(*Schizaphis graminum*)、西印度红圆盾蚧(*Selenaspidus articulatus*)、(*Sitobion avenae*)、白背稻虱(*Sogatella furcifera*)、桔二盆蚜(*Toxoptera citricida*)、结翅粉虱(*Trialetrodes abutilonea*)、温室白粉虱(*Trialetrodes vaporariorum*)葡萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)；

来自白蚁(等翅目)，例如，(*Calotermes flavicollis*)、白蚁(*Leucotermes flavipes*)、大白蚁(*Macrotermes subhyalinus*)、黑翅土白蚁(*Odontotermes formosanus*)、散白蚁(*Reticulitermes lucifugus*)、白蚁

(*Termes natalensis*);

来自直翅目昆虫(直翅目),例如欧洲蝼蛄(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、蝗虫(*Locusta migratoria*)、双带蚱蜢(*Melanoplus bivittatus*)、赤腿蚱蜢(*Melanoplus femur-rubrum*)、墨西哥蚱蜢(*Melanoplus mexicanus*)、迁徙蚱蜢(*Melanoplus sanguinipes*)、落矶山蚱蜢(*Melanoplus spretus*)、红翅蝗(*Nomadacris septemfasciata*)、美洲蝗(*Schistocerca americana*)、蚱蜢(*Schistocerca peregrina*)、(Stauronotus maroccanus)、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria*)、还有家蟋蟀(*Acheta domestica*)、东方蠊(*Blatta orientalis*)、德国小蠊(*Blattella germanica*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*);

来自蜘蛛亚纲,例如植食性螨类,如蕃茄刺皮瘿螨(*Aculops lycopersicae*)、刺皮瘿螨(*Aculops pelekassi*)、苹刺瘿螨(*Aculus schlechtendali*)、紫红短须螨(*Brevipalpus phoenicis*)、苜蓿苔螨(*Bryobia praetiosa*)、鹅耳枥始叶螨(*Eotetranychus carpini*)、始叶螨(*Eutetranychus banksii*)、桔瘿螨(*Eriophyes sheldoni*)、草地小爪螨(*Oligonychus pratensis*)、苹果全爪螨(*Panonychus Ulmi*)、柑桔全爪螨(*Panonychus citri*)、桔锈螨(*Phyllocoptruta Oleivora*)、侧多食跗线螨(*Polyphagotarsonemus Latus*)、跗线螨(*Tarsonemus pallidus*)、朱砂叶螨(*Tetranychus cinnabarinus*)、神泽叶螨(*Tetranychus kanzawi*)、太平洋叶螨(*Tetranychus pacificus*)、二点叶螨(*Tetranychus Urticae*)、蜱,例如美洲花蜱(*Amblyomma americanum*)、花蜱(*Amblyomma variegatum*)、波斯钝缘蜱(*Argas persicus*)、牛蜱(*Boophilus annulatus*)、牛蜱(*Boophilus decoloratus*)、微小牛蜱(*Boophilus microplus*)、森林革蜱(*Dermacentor silvarum*)、璃眼蜱(*Hyalomma truncatum*)、羊硬蜱(*Ixodes ricinus*)、硬蜱(*Zxodes rubicundus*)、非洲钝缘蜱(*Ornithodoros moubata*)、耳刺残喙蜱(*Otobius megnini*)、非洲扇头蜱(*Rhipicephalus appendiculatus*)和扇头蜱(*Rhipicephalus evertsi*)以及动物寄生螨,例如鸡皮刺螨(*Dermanyssus gallinae*)、羊痒螨(*Psoroptes ovis*)和疥螨(*Sarcoptes scabiei*);

来自线虫类,例如根瘤线虫,如根瘤线虫(*Meloidogyne hapla*)、

黄麻根瘤线虫 (*Meloidogyne incognita*)、根瘤线虫 (*Meloidogyne javanica*)、形成囊的线虫 (*Z. B. Globodera pallida*)、(*Globodera rostochiensis*)、异皮线虫, (*Heterodera avenae*)、异皮线虫 (*Heterodera glycines*)、史氏根瘤线虫 (*Heterodera Schachtii*), 迁移的内寄生和半内寄生线虫, 如 (*Helicotylenchus multicinctus*), (*Hirschmanniella oryzae*)、细带线虫 (*Hoplolaimus SPP*), 线虫 (*Pratylenchus brachyurus*)、线虫 (*Pratylenchus fallax*)、线虫 (*Pratylenchus penetrans*)、线虫 (*Pratylenchus vulnus*)、毕肖穿孔线虫 (*Radopholus similis*)、轮转线虫 (*Rotylenchus reniformis*)、(*Scutellonema bradys*)、垫刃线虫 (*Tylenchulus semipenetrans*)、茎和叶小线虫, 如蛇垫刃 (*Anguina tritici*)、稻白端滑刃线虫 (*Aphelenchoides besseyi*)、双垫刃 (*Ditylenchus angustus*)、双垫刃 (*Ditylenchus dipsaci*), 病毒媒介物, 如长针线虫 (*Longidorus SPP*), 克氏鬃根线虫 (*Trichodorus christei*)、线虫 (*Trichodorus viruliferus*)、剑线虫 (*Xiphinema index*)、剑线虫 (*Xiphinema mediterraneum*)。

活性化合物可以它们的制剂形式或由此制得的使用形式, 如以直接可喷洒溶液、粉末、悬浮液或分散液、乳液、油分散液、膏、粉末组合物、分散组合物或颗粒的形式, 通过喷洒、喷雾、撒粉、散布、浇洒而施用。施用形式完全取决于意欲的用途; 在每种情况下它们应尽可能保证使本发明的活性化合物最均匀的分散。

在一些情况下, 式 I 的化合物作为杀真菌剂具有系统活性。它们可用作叶子和土壤杀真菌剂, 抵抗宽范围的植物病理学真菌, 尤其是来自子囊菌纲、半知菌纲、藻形菌纲和担子菌纲的种类。

它们对于防治各种庄稼植物, 如小麦、黑麦、大麦、燕麦、稻、玉米、牧草、棉花、大豆、咖啡、甘蔗、葡萄、水果和装饰植物以及蔬菜植物, 如黄瓜、扁豆和南瓜, 以及这些植物的种子上的多种真菌尤为重要。

化合物 I 特别适宜于防治下列植物疾病:

- * 谷类作物上的禾白粉菌 (*Erysiphe graminis*) (白粉菌),
- * 南瓜上的白粉菌 (*Erysiphe cichoralearum*) 和单丝壳菌

(*Sphaerotheca fuliginea*),

- * 苹果上的叉丝单囊壳菌(*Podosphaera leucotricha*),
- * 藤本植物上的钩丝壳菌(*Vincinula necator*),
- * 谷类作物上的柄锈菌(*Puccinia species*),
- * 棉花和牧草上的丝核菌(*Rhizoctonia species*),
- * 谷类作物和甘蔗上的黑粉菌(*Ustilago species*),
- * 苹果上的黑星菌(*Venturia inaequalis cscab*),
- * 谷类作物上的长孢孢(*Helminthosporium species*),
- * 小麦上的壳针孢(*Septoria nodorum*),
- * 草莓、藤本植物上的葡萄孢(*Botrytis cinerea*)(gray mold),
- * 花生上的尾孢菌(*Cercospora arachidicola*),
- * 小麦、大麦上的 *Pseudocercospora herpotrichoides*,
- * 稻上的 *Pyricularia Oryzae*,
- * 马铃薯和蕃茄上的流行病疫(*phytophthora infestans*),
- * 各种植物上的镰孢霉(*Fusarium*)和轮枝孢菌(*Verticillium*),
- * 藤本植物上的单轴霉(*Plasmopara viticola*),
- * 蔬菜和水果上的交链孢霉(*Alternaria*)。

本发明化合物还可用于材料的保护(例如保护木材、纸和织物),如抵抗多变形青霉(*Paecilomyces Variotii*)。

它们可被转化成常规的剂型,如溶液剂、乳状剂、悬浮剂、粉剂、粉末剂、膏剂或颗粒剂。使用形式取决于特定的预定用途,在每一种情况下,它们应尽可能使活性化合物最均匀的分散。

制剂用已知方式制备,如通过用溶剂和/或载体填充活性化合物,如果需要,使用乳化剂和分散剂,其中如果水被用作稀释剂,还可使用其它有机溶剂作为辅助溶剂。

用于这一目的的适宜助剂主要为:

——溶剂,如芳香化合物(如二甲苯),氟代芳香化合物(如氟苯)、石蜡烃(如石油馏分)、醇(如甲醇、丁醇)、酮(如环己酮)、胺(如乙醇胺、二甲基甲酰胺)和水;

——载体,如磨得很细的天然矿石(如高岭土、矾土、滑石、白垩)和磨

得很细的合成矿石(如高度分散的硅石、硅酸盐);

——乳化剂,如非离子和阴离子型乳化剂(如聚氧乙烯脂肪醇醚、烷基磺酸盐和芳基磺酸盐)和

——分散剂,如木素-亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

适宜的表面活性物质为芳香磺酸如木素磺酸、苯酚磺酸、萘磺酸和二丁基萘磺酸以及脂肪酸的碱金属盐、碱土金属盐和铵盐,烷基和烷基芳基磺酸盐,烷基、月桂基醚和脂肪醇硫酸盐以及硫酸化的十六、十七和十八醇的盐,还有脂肪醇二醇醚的盐,磺化的萘和它的衍生物与甲醛的缩合产物,萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合产物,聚氧乙烯辛酚醚,乙氧基化的异辛基、辛基或壬基酚,烷基苯酚或三丁基苯基聚乙二醇醚,烷基芳基聚醚醇,异十三烷基醇,脂肪醇环氧乙烷缩合产物,乙氧基化的蓖麻油,聚氧乙烯烷基醚或聚氧丙烯烷基醚,月桂基醇聚乙二醇醚乙酸酯,山梨糖醇酯,木素亚硫酸盐废液或甲基纤维素。

含水使用形式可通过向乳液浓缩剂、分散剂、膏剂、可湿粉末剂或水可分散的颗粒剂中加入水来制备。为了制备乳剂、膏剂或油分散剂,可借助于湿润剂、粘合剂、分散剂或乳化剂将被用物均化在水中或溶解在油或溶剂中。然而,也可制备宜于用水稀释的由活性物质、湿润剂、粘合剂、分散剂或乳化剂和可能的溶剂或油组成的浓缩剂。

粉剂、散布剂和撒粉组合物可通过将活性物质与固体载体混合或共同研磨而制备。

颗粒剂如涂布的、浸渍的和均匀的颗粒剂可通过将活性化合物结合到固体载体上而制备。

固体载体为:矿物土,如硅胶、硅酸、硅酸盐、滑石、高岭土、石灰石、石灰,白垩、红玄武石、黄土、粘土、白云石、硅藻土、硫酸钙和硫酸镁、氧化镁;磨得很细的合成物质、肥料,如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素,和植物产品,例如谷粉、树皮粉、木粉和坚果粉,纤维素粉末或其它固体载体。活性化合物在待用制剂中的浓度可在相当宽的范围内变化。

最一般的情况下,组合物含有 0.0001~95% (重量) 的活性化合物。

含有大于 95% (重量) 的活性化合物的制剂可被极其成功地运用于超低体积方法(ULV)中,它甚至可只使用活性化合物而没有添加剂。

用作杀真菌剂时,活性化合物的浓度为 0.01~95% (重量)、优选 0.5~90% (重量)。用作杀虫剂时,含有 0.0001~10% (重量)、优选 0.01~1% (重量) 的活性化合物的制剂是适宜的。

活性化合物通常以 90%~100%、优选 95%~100% 的纯度(按照 NMR 谱)使用。

这些制剂的实例为:

I. 90 份(重量)本发明化合物 I 和 10 份(重量)N-甲基- α -吡咯烷酮的溶液,它宜于以非常小的液滴形式使用;

II. 20 份(重量)本发明化合物 I 在 80 份(重量)烷基化苯、10 份(重量)8-10mol 环氧乙烷与 1mol 的油酸 N-羟乙基酰胺的加成产物、5 份(重量)十二烷基苯磺酸的钙盐、5 份(重量)40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油的加成产物组成的混合物中的溶液;通过将该制剂很好地分散在水中而获得分散剂;

III. 20 份(重量)本发明化合物 I 在 40 份(重量)环己酮、30 份(重量)异丁醇、20 份(重量)7mol 环氧乙烷与 1mol 异辛基苯酚的加成产物和 10 份(重量)40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油的加成产物组成的混合物中的溶液;通过将该制剂很好地分散在水中而获得分散剂;

IV. 20 份(重量)本发明化合物 I 在 25 份(重量)环己酮、65 份(重量)沸点为 210~280℃ 的石油馏分和 10 份(重量)40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油的加成产物组成的混合物中的含水分散剂;通过将该制剂很好地分散在水中而获得分散剂;

V. 在锤磨机中研磨由 20 份(重量)本发明化合物 I、3 份(重量)二异丁基苯- α -磺酸的钠盐、17 份(重量)来自亚硫酸废液的木素磺酸的钠盐和 60 份(重量)粉状硅胶组成的混合物;喷洒混合物通过

将该混合物很好地分散在水中而获得；

VI. 3份(重量)本发明化合物 I 和 97份(重量)的细粉高岭土组成的紧密混合物；这种撒粉组合物含有 3%(重量)的活性化合物；

VII. 30份(重量)本发明化合物 I、92份(重量)粉状硅胶和 8份(重量)已喷洒到硅胶表面上的液体石蜡组成的紧密混合物；这种制剂给予了活性化合物良好的粘性；

VIII. 40份(重量)本发明化合物 I、10份(重量)的苯酚磷酸/尿素/甲醛缩合物的钠盐、2份(重量)硅胶和 48份(重量)水组成的稳定的水分散体，它可进一步被稀释；

IX. 20份(重量)本发明化合物 I、2份(重量)十二烷基苯磷酸的钙盐、8份(重量)脂肪醇聚乙二醇醚、2份(重量)苯酚磷酸/尿素/甲醛缩合物的钠盐和 68份(重量)石蜡矿物油组成的稳定的油分散剂；

X. 在锤磨机中研磨由 10份(重量)本发明化合物 I、4份(重量)二异丁基萘- α -磷酸的钠盐、20份(重量)的来自亚硫酸废液的木素磷酸的钠盐、38份(重量)硅胶和 38份(重量)高岭土组成的混合物。通过将该混合物很好地分散在 10,000份(重量)水中，获得含有 0.1%(重量)的活性化合物的喷洒混合物。

通过用杀真菌活性量的活性化合物处理要保护免受真菌侵袭的种子、植物、材料或土壤来使用化合物 I。

在材料、植物或种子被真菌感染之前或之后使用它们。

根据所需达到的效果的类型，施用剂量为 0.02-3kg 活性化合物/公顷，优选 0.1-1kg/公顷。

在处理种子时，需要活性化合物的量一般为 0.001-50g/千克种子，优选 0.01-10g/千克种子。

在室外条件防治害虫时，活性化合物的用量为 0.02-10kg/公顷，优选 0.1-2.0kg/公顷。

化合物 I 本身或与除草剂或杀真菌剂结合还可与其它作物保护剂一起混合使用，例如与生长调节剂或害虫或细菌防治剂一起使用，还可与肥料或用来消除营养和痕量元素缺少的矿物盐溶液一起使用。

作物保护剂和肥料可以重量比为 1:10~10:1 的比例加入到本发明的组合物中,如果适宜甚至在使用之前立即加入(桶混合)。在与杀真菌剂或杀虫剂混合时,在许多情况下获得了杀真菌作用范围的增大。

可与根据本发明的化合物一起使用的下列杀真菌剂意在说明这种结合的可能性,但不限于它们:

硫、二硫代氨基甲酸盐和它们的衍生物,例如二甲基二硫代氨基甲酸铁、二甲基二硫代氨基甲酸锌、亚乙基双二硫代氨基甲酸锌、亚乙基双二硫代氨基甲酸锰、亚乙基二胺双二硫代氨基甲酸锌锰、二硫化四甲基秋兰姆、N,N-亚乙基双二硫代氨基甲酸锌的氮配合物、N,N'-亚丙基双二硫代氨基甲酸的氮配合物、N,N'-亚丙基双二硫代氨基甲酸锌、N,N'-多亚丙基双(氨基硫羰基)二硫化物;硝基衍生物,例如巴豆酸二硝基(1-甲基庚基)苯酯、3,3-二甲基丙烯酸 2-仲丁基-4,6-二硝基苯酯、异丙基碳酸 2-仲丁基-4,6-二硝基苯酯、5-硝基间苯二甲酸二异丙酯;

杂环物质,例如 2-十七烷基-2-咪唑啉乙酸酯、2,4-二氟-6-(邻-氟苯胺基)-s-三嗪、O,O-二乙基苯二甲酰亚氨基胍酰基硫酯、5-氨基-1-β-[双-(二甲基氨基)-氧胍基]-3-苯基-1,2,4-三唑、2,3-二氟基-1,4-二硫代蒽醌、2-硫代-1,3-二硫基-β-[4,5-b]噻啉、1-(丁基氨基甲酰基)-2-苯并咪唑氨基甲酸甲酯、2-甲氧基羰基氨基苯并咪唑、2-(咪喃-2-基)苯并咪唑、2-(噻唑-4-基)苯并咪唑、N-(1,1,2,2-四氟乙硫基)四氢苯邻二甲酰亚胺、N-三氟甲硫基四氢苯邻二甲酰亚胺、N-三氟甲硫基苯邻二甲酰亚胺、N-二氟一氟甲硫基-N',N'-二甲基-N-苯基硫酰胺、5-乙氧基-3-三氟甲基-1,2,3-噻二唑、2-氟硫基甲基硫代苯并噻唑、1,4-二氟-2,5-二甲氧基苯、4-(2-氟苯基亚胍基)-3-甲基-5-异噻唑酮、2-硫代吡啶-1-氧化物、8-羟基喹啉或它的铜盐、2,3-二氢-5-羧酰苯胺基-6-甲基-1,4-氧硫杂环己二烯、2,3-二氢-5-羧酰苯胺基-6-甲基-1,4-氧硫杂环己二烯-4,4-二氧化物、2-甲基-5,6-二氢-4H-

吡喃-3-羧酰苯胺、2-甲基吡喃-3-羧酰苯胺、2,5-二甲基吡喃-3-羧酰苯胺、2,4,5-三甲基吡喃-3-羧酰苯胺、N-环己基-2,5-二甲基吡喃-3-羧酰胺、N-环己基-N-甲氧基-2,5-二甲基吡喃-3-羧酰胺、2-甲基-N-苯甲酰苯胺、2-碘-N-苯甲酰苯胺、N-甲酰基-N-吗啉-2,2,2-三氯乙基乙缩醛、哌嗪-1,4-二基双(1-(2,2,2-三氯乙基)甲酰胺、1-(3,4-二氯苯胺基)-1-甲酰氨基-2,2,2-三氯乙烷、2,6-二甲基-N-十三烷基吗啉或它的盐、2,6-二甲基-N-环十二烷基吗啉或它的盐、N-[3-(对叔丁基苯基)-2-甲基丙基]-顺-2,6-二甲基吗啉、N-[3-(对叔丁基苯基)-2-甲基丙基]哌啶、1-[2-(2,4-二氯苯基)-4-乙基-1,3-二氧戊环-2-基乙基]-1H-1,2,4-三唑、1-[2-(2,4-二氯苯基)-4-正丙基-1,3-二氧戊环-2-基-乙基]-1H-1,2,4-三唑、N-正丙基-N-(2,4,6-三氯苯氧基乙基)-N-咪唑基脲、1-(4-氯-苯氧基)-3,3-二甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-2-丁酮、1-(4-氯苯氧基)-3,3-二甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-2-丁醇、 α -(2-氯苯基)- α -(4-氯苯基)-5-噻唑甲醇、5-丁基-2-二甲基氨基-4-羟基-6-甲基噻唑、双(对-氯苯基)-3-吡啶乙醇、1,2-双(3-乙氧羰基-2-硫脲基)苯、1,2-双(3-甲氧羰基-2-硫脲基)苯。

还有各种杀真菌剂,例如十二烷基乙酸胍、3-[3-(3,5-二甲基-2-氧基环己基)-2-羟基乙基]戊二酰亚胺、六氯苯、DL-N-(2,6-二甲基苯基)-N-2-糠酰基丙氨酸甲酯、DL-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(2'-甲氧基乙酰基)丙氨酸甲酯、N-(2,6-二甲基苯基)-N-氯乙酰基-D,L-2-氨基丁内酯、DL-N-(2,6-二甲基苯基)-N-(苯基乙酰基)丙氨酸甲酯、5-甲基-5-乙烯基-3-(3,5-二氯苯基)-2,4-二氧代-1,3-噁唑烷、3-(3,5-二氯苯基)-5-甲基-5-甲氧基甲基-1,3-噁唑烷-2,4-二酮、3-(3,5-二氯苯基)-1-异丙基氨基甲酰基乙内酰脲、N-(3,5-二氯苯基)-1,2-二甲基-环丙烷-1,2-二羧酰亚胺、2-氧基-[N-乙基氨基羰基-2-甲氧亚氨基]乙酰胺、1-[2-(2,4

-二氟苯基)戊基]-1H-1,2,4-三唑、2,4-二氟- α -(1H-1,2,4-三唑基-1-甲基)二苯甲醇、N-(3-氟-2,6-二硝基-4-三氟甲基苯基)-5-三氟甲基-3-氟-2-氨基吡啶、1-((双(4-氟苯基)甲基甲硅烷基)甲基)-1H-1,2,4-吡唑。

合成实施例

使用下列合成实施例中所述的方法,适当改变起始化合物,得到其它化合物 I。如此制得的化合物及其物化数据列于下表中。

1. N-(2-(N'-(对-甲基苯基)-4'-氟-吡唑基-3'-氧甲基)苯基)-N-甲氧基氨基甲酸甲酯(表中化合物 No. 19)

在室温下,将 1.7g(纯度约 75%,约 4.6mmol)N-(2-溴甲基苯基)-N-甲氧基氨基甲酸甲酯(WO 93/15046)、1g(4.8mmol)N-(对-甲基苯基)-4-氟-3-羟基吡唑和 1g(7.2mmol)K₂CO₃ 在 15ml DMF 中的混合物搅拌过夜。反应混合物用水稀释,水相用甲基叔丁基醚萃取 3 次。合并的有机相用水萃取,用 MgSO₄ 干燥并浓缩。然后,用二氟甲烷在 AlO₃ 上、随后用环己烷/乙酸乙酯混合物在硅胶上将残余物层析。得到 1.4g(68%)标题化合物,为浅黄色油状物。

¹H-NMR(CDCl₃; δ ppm): 7.75 (s, 1H, 吡唑基); 7.70 (m, 1H, 苯基); 7.5 (m, 5H, 苯基); 7.2 (d, 2H, 苯基); 5.4 (s, 2H, OCH₂); 3.75, 3.8 (2s, 2x 3H, 2 x OCH₃); 2.35 (s, 3H, CH₃)

2. N-甲基-N'-甲氧基-N'-(2-((N''-吡嗪基)吡唑基-3''-氧甲基)苯基)脲(表中化合物 No. 32)

a) N-羟基-N-(2-甲基苯基)氨基甲酸苯酯

在剧烈搅拌下,在约-10℃用 447g(2.85mol)氟甲酸苯酯处理 350g(纯度约 80%,2.3mol,类似于 Bamberger 等人在 Ann. Chem. 316 (1901), 278 中公开的方法制备) N-(2-甲基苯基)羟胺和 286.8g(3.4mol)NaHCO₃ 在 700ml CH₂Cl₂ 中的混合物。将该混合物在-10℃搅拌约 1 小时,然后滴加入 600ml 水,反应混合物的温度升至 5-10℃,剧烈逸出气体。然后分出水相,用 CH₂Cl₂ 萃取 1 次。

合并的有机相用水萃取,用 MgSO_4 干燥并浓缩。将残余物与环己烷一起搅拌,使其结晶。得到 407g(72%)标题化合物,为无色固体。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta(\text{ppm}))$: 8.6 (s, 宽峰, 1H, OH); 7.0—7.4 (m, 9H, 苯基), 2.4 (s, 3H, CH_3)

b) N—甲氧基—N—(2—甲基苯基)氨基甲酸苯酯

用 211g(1.67mol)硫酸二甲酯滴加处理 407g(1.6mol)N—羟基—N—(2—甲基苯基)氨基甲酸酯(实施例 2a)和 277g(2.0mol) K_2CO_3 在 700ml CH_2Cl_2 中的混合物。此间反应混合物的温度温热至约 40°C 。将反应混合物在室温搅拌过夜,然后用硅藻土过滤。滤液用氨水和水洗涤,用 MgSO_4 干燥并浓缩。将残余物与己烷一起搅拌结晶。得到 324g(75%)标题化合物,为无色固体。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta(\text{ppm}))$: 7.1—7.6 (m, 9H, 苯基); 3.8 (s, 3H, OCH_3); 2.4 (s, 3H, CH_3)

c) N—甲氧基—N—(2—溴甲基苯基)氨基甲酸苯酯

用 300W 紫外灯辐照 324g(1.3mol)N—甲氧基—N—(2—甲基苯基)氨基甲酸苯酯(实施例 2b)、258g(1.45mol)N—溴代琥珀酰亚胺和 1g 偶氮双异丁腈在 1 升 CCl_4 中的混合物约 6 小时,从而将该反应混合物加热至沸腾。然后加入 13g N—溴代琥珀酰亚胺,并将该混合物辐照 8 小时。然后冷却至室温,过滤出沉淀的琥珀酰亚胺。然后将有机相用水萃取,用 MgSO_4 干燥并浓缩。将残余物与环己烷一起搅拌结晶。得到 300g(68%)标题化合物,它为米色固体。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta(\text{ppm}))$: 7.0—7.6 (m, 9H, 苯基); 4.65 (s, 2H, $\text{CH}_2\text{—Br}$); 3.9 (s, 3H, OCH_3)

d) N—甲氧基—N—(2—(N'—吡嗪基)吡唑基—3'—氧甲基)苯基)氨基甲酸苯酯

在室温下,将 3.1g(9.2mmol) N—甲氧基—N—(2—溴甲基苯基)氨基甲酸苯酯(实施例 2c)、1.5g(9.2mmol)N—吡嗪基—3—羟基吡唑和 2g(14.5mmol) K_2CO_3 在 10ml DMF 中的混合物搅拌过夜。然后将反应混合物用水稀释,用甲基叔丁基醚萃取 3 次。合并的有机相用水萃取,用 MgSO_4 干燥并浓缩。将残余物用环己烷/乙酸乙

酯混合物进行柱色谱提纯。得到 2.4g(63%)标题化合物,为黄色油状物。

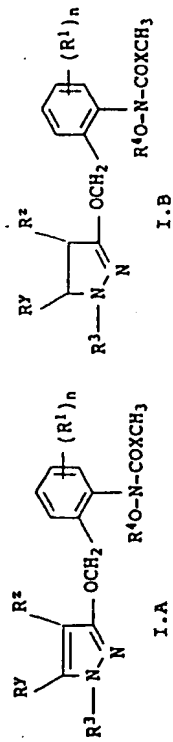
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3; \delta \text{ ppm}): 9.15 (\text{d}, 1\text{H}, \text{吡啶基}); 8.3 (\text{m}, 3\text{H}, \text{吡啶基}); 7.7 (\text{m}, 1\text{H}, \text{苯基}); 7.1-7.6 (\text{m}, 8\text{H}, \text{苯基}); 6.0 (\text{d}, 1\text{H}, \text{吡啶基}); 5.5 (\text{s}, 2\text{H}, \text{OCH}_2); 3.85 (\text{s}, 3\text{H}, \text{OCH}_3)$

e)N—甲基—N'—甲氧基—N'—(2—((N"—吡啶基)吡啶基—3"—氧甲基)苯基)脒

将 1.9g(4.6mmol)N—甲氧基—N—(2—((N'—吡啶基)吡啶基—3'—氧甲基)苯基)氨基甲酸苯酯(实施例 2d)和 15ml 甲胺水溶液(浓度为 40%)的混合物在室温搅拌过夜。然后加入水,水相用 CH_2Cl_2 萃取 2 次。合并的有机相用水洗涤,用 MgSO_4 干燥并浓缩。将残余物与环己烷一起搅拌结晶。得到 0.9g(55%)标题化合物,为米色固体。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3; \delta \text{ ppm}): 9.15 (\text{d}, 1\text{H}, \text{吡啶基}); 8.3 (\text{m}, 3\text{H}, \text{吡啶基}); 7.6 (\text{m}, 1\text{H}, \text{苯基}); 7.35 (\text{m}, 3\text{H}, \text{苯基}); 6.0 (\text{m}, 2\text{H}, \text{NH}, \text{吡啶基}); 5.45 (\text{s}, 2\text{H}, \text{OCH}_2); 3.7 (\text{s}, 3\text{H}, \text{OCH}_3); 2.9 (\text{d}, 3\text{H}, \text{NCH}_3)$

表 1



编号	结构	R ¹ _n	R ^Y	R ^Z	R ³	R ⁴	X	M.p. [°C], IR [cm ⁻¹]
1	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	O	1737, 1600, 1493, 1480, 1456, 1358, 1332, 755
2	I.A	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1737, 1547, 1503, 1480, 1457, 1441, 1350, 1094, 1030, 936
3	I.A	H	H	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	1739, 1547, 1492, 1475, 1457, 1440, 1356, 1107, 1058, 1027
4	I.A	H	H	H	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1739, 1710, 1542, 1482, 1457, 1440, 1358, 1052, 1030, 763
5	I.A	H	H	H	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1738, 1593, 1545, 1494, 1483, 1457, 1441, 1357, 1056, 1032
6	I.A	H	H	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1738, 1544, 1519, 1482, 1456, 1440, 1393, 1358, 1243, 1031,

编号	结构	R ¹ _n	R ^v	R ^z	R ³	R ⁴	X	M.p. [°C], IR [cm ⁻¹]
7	I.A	H	H	H	2-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1739, 1710, 1546, 1495, 1476, 1453, 1441, 1358, 1027, 757
8	I.A	H	H	H	3-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1736, 1597, 1548, 1495, 1476, 1456, 1440, 1357, 1101, 771
9	I.A	H	H	H	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	1727, 1543, 1464, 1445, 1364, 1348, 791, 785, 749,
10	I.A	H	H	H	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	120
11	I.A	H	H	H	2,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃		O	1737, 1710, 1547, 1489, 1471, 1456, 1437, 1346, 1096, 1027
12	I.A	H	H	H	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	85
13	I.A	H	H	H	2-CH ₃ , 4-Cl-C ₆ H ₃	CH ₃	O	1738, 1710, 1543, 1494, 1480, 1457, 1441, 1358, 1100, 940
14	I.A	H	H	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1721, 1558, 1459, 1441, 1368, 1333, 1121, 1067, 793, 764
15	I.A	H	H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1737, 1541, 1517, 1483, 1457, 1442, 1359, 1250, 1056, 1032
16	I.A	H	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CH ₃	O	1739, 1710, 1560, 1504, 1484, 1456, 1440, 1380, 1359, 760
17	I.A	H	H	CH ₃ O-CO	C ₆ H ₅	CH ₃	O	1720, 1702, 1570, 1540, 1446, 1372, 1357, 1285, 1119, 751
18	I.A	H	H	H	4-F-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1737, 1546, 1516, 1482, 1457, 1440, 1359, 1233, 1031, 835

编号	结构	R ¹ⁿ	R ^y	R ^z	R ³	R ⁴	X	M.p. [°C], IR [cm ⁻¹]
19	I.A	H	H	Cl	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1738, 1554, 1509, 1456, 1440, 1358, 1253, 1118, 940, 760
20	I.A	H	3-F	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	90
21	I.A	H	3-F	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	109
22	I.A	H	H	H	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1737, 1607, 1597, 1545, 1499, 1482, 1472, 1440, 1358
23	I.A	H	H	Cl	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	110
24	I.A	H	CF ₃	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1739, 1507, 1486, 1457, 1359, 1250, 1190, 1139, 1109, 1092
25	I.A	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	1738, 1710, 1567, 1561, 1500, 1484, 1456, 1440, 1359, 1104
26	I.A	H	H	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1729, 1553, 1511, 1497, 1438, 1356, 1332, 1265, 1122, 1112
27	I.A	H	H	H	3,4-(OCF ₂ O)-C ₆ H ₃	CH ₃	O	97
28	I.A	H	H	H	2-吡啶基	CH ₃	O	85
29	I.A	H	H	H	5-CF ₃ -吡啶基-2	CH ₃	O	81
30	I.A	H	H	H	2-吡啶基	CH ₃	O	87
31	I.B	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	O	1739, 1639, 1599, 1501, 1456, 1439, 1411, 1354, 1252, 752
32	I.A	H	H	H	2-吡啶基	CH ₃	NH	145
33	I.A	H	H	NO ₂	5-CF ₃ -吡啶基-2	CH ₃	O	126

编号	结构	R ¹ _n	R ^y	R ²	R ³	R ⁴	X	M.p. [°C], IR [cm ⁻¹]
34	I.A	H	CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1738, 1561, 1500, 1456, 1440, 1359, 1094, 1010, 764
35	I.A	H	H	H	6-Cl-吡啶-3-基	CH ₃	O	135
36	I.A	H	H	H	5-Cl-吡啶-2-基	CH ₃	O	77
37	I.A	H	H	CF ₃	环己基	CH ₃	O	1743, 1496, 1456, 1441, 1359, 1272, 1262, 1176, 1124, 1029
38	I.A	H	H	Cl	5-Cl-吡啶-2-基	CH ₃	O	92
39	I.A	H	H ₃ CO ₂ C	H	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	O	71
40	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	H	O	1718, 1600, 1545, 1507, 1481, 1458, 1399, 1359, 1032, 757
41	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	NH	1675, 1600, 1545, 1508, 1479, 1462, 1399, 1355, 1054, 756
42	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	-	1680, 1600, 1545, 1507, 1480, 1456, 1359, 1056, 1032, 758
43	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	H	NH	1653, 1601, 1545, 1707, 1479, 1454, 1414, 1398, 1355, 755
44	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₂	1678, 1600, 1545, 1480, 1456, 1394, 1378, 1358, 1055, 756
45	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	H	-	1643, 1622, 1601, 1544, 1493, 1480, 1368, 1027, 759, 745
46	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	H	CH ₂	1619, 1600, 1550, 1495, 1482, 1462, 1454, 1358, 765, 753
47	I.A	H	H	H	2,4-Cl ₂ -苯基	CH ₃	NH	130

编号	结构	R ¹ _n	R ^y	R ^z	R ^j	R ^k	X	M.p. [°C], IR [cm ⁻¹]
48	I.A	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	O	105
49	I.A	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	NH	1653, 1546, 1503, 1480, 1455, 1426, 1390, 1357, 1094, 1071
50	I.A	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	NH	1675, 1546, 1503, 1479, 1457, 1425, 1389, 1355, 936, 829
51	I.A	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	O	1737, 1709, 1537, 1488, 1456, 1439, 1359, 1325, 1032, 733
52	I.A	H	H	H	CH ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	CH ₃	O	1735, 1709, 1538, 1492, 1456, 1439, 1358, 1323, 1096, 761
53	I.A	H	H	H	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	92
54	I.A	H	H	Cl	2-硝基基	CH ₃	O	114
55	I.B	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1740, 1639, 1599, 1495, 1456, 1439, 1415, 1355, 1251, 1092
56	I.A	H	H	H	2-Cl, 4-F-C ₆ H ₃	CH ₃	O	1737, 1547, 1505, 1494, 1480, 1457, 1441, 1358, 1258, 1028

抵抗有害真菌的活性的实施例

通过下面实验可以证明式 I 化合物的杀真菌活性:

将活性化合物制备成在 70% (重量) 环己酮、20% (重量) Nekanil® LN (Lutensol® AP6, 基于乙氧基化的烷基苯酚的具有乳化和分散作用的湿润剂) 和 10% (重量) Emulphor® EL (Emulan® EL, 基于乙氧基化的脂肪醇的乳化剂) 组成的混合物中的 20% 浓度的乳液, 并相应地用水稀释至所需浓度。

抵抗小麦叶锈病菌 (*Puccinia recondita*) 的活性

将叶锈病菌的孢子撒粉于小麦秧苗 (变种: Kanzler) 的叶子上。将如此处理的植物在 20—22℃ 和相对湿度为 90—95% 下培养 24 小时, 然后用活性化合物的制剂 (含 63ppm 的活性化合物) 处理。在 20—22℃ 和 65—70% 的相对湿度下继续培养 8 天后。通过肉眼观察, 确定真菌病害发生的情况。

在这个试验中, 用本发明化合物 2—6、8、11—15、18—20、22、23 和 26—29 处理的植物的发病率为 5% 或更少, 而用 WO—A 93/15046 中公开的化合物 (表 7, 实施例 8) 处理的植物的发病率为 25%。未处理植物的发病率为 70%。

在相应的试验中, 用 250ppm 本发明化合物 1 处理的植物的发病率为 3%, 而用 250ppm WO—A 93/15 046 中公开的化合物 (表 7, No. 21) 处理的植物的发病率为 70%, 与未处理的一样。

在相应的试验中, 用 250ppm 本发明化合物 1—8、10—16、18—20、22、23、27—30、34、36—38、41、47 和 51—56 处理的植物的发病率为 15% 和更低, 而用 250ppm WO—A 93/15 046 中公开的化合物 (表 7, No. 21) 处理的植物的发病率为 70%, 与未处理的一样。

抵抗单轴霉 (*Plasmopara viticola*) 的活性

用活性化合物制剂喷洒盆栽的葡萄藤 (变种: Müller Thurgau) 直至滴湿。8 天后, 用单轴霉菌的游动孢子的悬浮液喷洒植物, 在 20—30℃ 和高空气湿度下保持 5 天。在评价前, 接着将植物在高空气湿度下保持 16 小时。肉眼进行评价。

在这个试验中, 用本发明化合物 1—3、5、6、13、15 和 29 处理的

植物有 10% 或更少发生病害, 然而用 WO—A 39/15 046 中公开的化合物(表 7, 实施例 8)处理的植物的发病率为 25%。未处理的植物的发病率为 70%。

抵抗灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*)的活性

用活性化合物的制剂喷雾具有 4—5 个叶片的 Paprika 秧苗(变种: Neusiedler Ideal Elite), 直至滴湿(施用率: 500ppm)。干燥后, 用灰葡萄孢的分生孢子的悬浮液喷雾这些植物, 在 22—24℃ 和高空气温下保持 5 天。肉眼观察进行评价。

在这个试验中, 用本发明化合物 1 处理的植物无病害发生。而用 WO—A 93/15 046 中公开的化合物(表 7, No. 21)处理的植物的发病率为 70%。未处理植物的发病率为 80%。

抵抗禾白粉菌(*Erysiphe graminis* var. *tritici*)的活性

首先用活性化合物的含水制剂处理小麦秧苗(Friihgold 变种)的叶子(施用率: 250ppm)。约 24 小时后, 用小麦霉菌(禾白粉菌)的孢子撒粉于植物上。接着将用这种方式处理的植物在 20—22℃ 和相对湿度为 75—80% 下培养 7 天。接着确定真菌病害发生情况。

在这个试验中, 用本发明化合物 1 处理的植物无病害发生, 而用 WO—A 93/15 046 中公开的化合物(表 7, No. 21)处理的植物的发病率为 25%。未处理植物的发病率为 70%。

在相应的试验中, 用 250ppm 本发明化合物 1—7、10、13、14、18—20、27—29、34、36、41、50 和 56 处理的植物的发病率为 15% 或更低, 而用 250ppm WO—A 93/15 046 中公开的化合物(表 7, No. 21)处理的植物的发病率为 25%。未处理植物的发病率为 70%。

在相应的试验中, 用 63ppm 本发明化合物 1—7、10、13、14、18—20、27—29、34、36、41、50 和 56 处理的植物的发病率为 15% 或更低, 而用 63ppm WO—A 93/15 046 中公开的化合物(表 7, No. 21)处理的植物的发病率为 40%。未处理植物的发病率为 70%。

在相应的试验中, 用 16ppm 本发明化合物 1—7、10、13、14、18—20、27—29、34、36、41、50 和 56 处理的植物的发病率为 25% 或更低, 而用 16ppm WO—A 93/15 046 中公开的化合物(表 7, No. 21)处理

的植物的发病率为65%。未处理植物的发病率为70%。

抵抗动物害虫的活性的实施例

用下列试验可以证明本发明式I化合物抵抗动物害虫的活性：

将活性化合物制备成

a)在丙酮中的0.1%浓度的溶液，或者

b)在70wt%环己酮、20wt% Nekanil[®] LN (Lutensol[®] AP6, 一种基于乙氧基化烷基酚的、具有乳化和分散作用的试剂)和10wt% Wettol[®] (一种基于乙氧基化蓖麻油的非离子型乳化剂)的混合物中的10%浓度的乳液；并且，在a)的情况下用丙酮稀释、在b)的情况下用水稀释至所需浓度。

试验结束后，确定达到80—100%的抑制或致死率(与未处理的参比对比)时化合物的最低浓度(活性最低浓度)。